

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2002 年 10 月 31 日 (31.10.2002)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 02/085905 A1(51) 国際特許分類: C07D 473/16, 473/18,  
473/24, A61K 31/52, A61P 11/06, 17/00, 31/12, 31/18,  
31/20, 35/00, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00

[JP/JP]; 〒541-8510 大阪府 大阪市 中央区道修町二丁目2番8号 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/03727

(72) 発明者; および

(22) 国際出願日: 2002 年 4 月 15 日 (15.04.2002)

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 磯部 義明 (ISOBE, Yoshiaki) [JP/JP]; 〒335-8502 埼玉県 戸田市 新曽南三丁目17番35号 株式会社ジャパンエナジー内 Saitama (JP). 荻田 晴久 (OGITA, Haruhisa) [JP/JP]; 〒335-8502 埼玉県 戸田市 新曽南三丁目17番35号 株式会社ジャパンエナジー内 Saitama (JP). 戸辺 雅則 (TOBE, Masanori) [JP/JP]; 〒335-8502 埼玉県 戸田市 新曽南三丁目17番35号 株式会社ジャパンエナジー内 Saitama (JP). 高久 春雄 (TAKAKU, Haruo) [JP/JP]; 〒335-8502 埼玉県 戸田市 新曽南三丁目17番35号 株式会社ジャパンエナジー内 Saitama (JP). 荻野 哲広 (OGINO, Tetsuhiro) [JP/JP]; 〒561-0802 大阪府 豊中市 曽根東町2-10-4-433 Osaka (JP). 栗本 歩 (KURIMOTO, Ayumu) [JP/JP]; 〒658-0001 兵庫県 神戸市 東灘区森北町三丁目4-30-103 Hyogo (JP). 川上

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

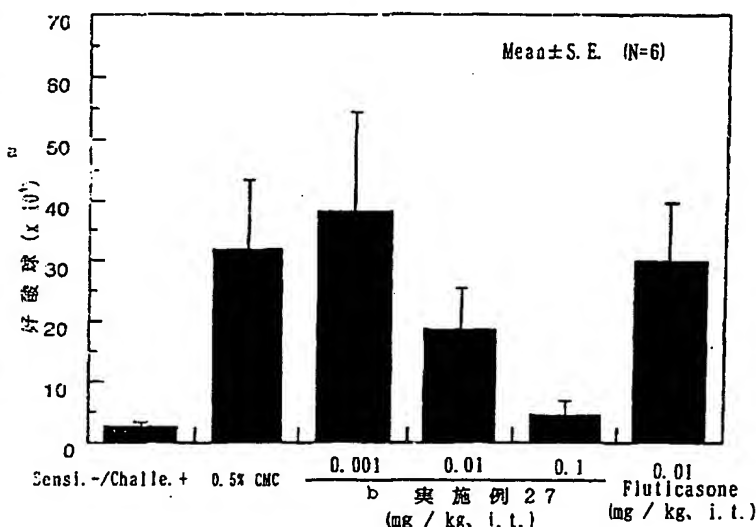
(30) 優先権データ:  
特願2001-118232 2001 年 4 月 17 日 (17.04.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社ジャパンエナジー (JAPAN ENERGY CORPORATION) [JP/JP]; 〒105-8407 東京都 港区 虎ノ門二丁目10番1号 Tokyo (JP). 住友製薬株式会社 (SUMITOMO PHARMACEUTICALS COMPANY, LIMITED)

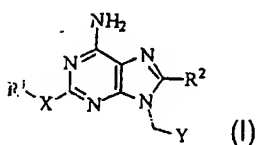
[続葉有]

(54) Title: NOVEL ADENINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: 新規アデニン誘導体

a...EOSINOPHIL (X10<sup>4</sup>)

b...EXAMPLE 27 (mg/kg, i. t.)



(57) Abstract: Adenine derivatives represented by the following general formula (I) wherein X represents NR<sup>3</sup> (wherein R<sup>3</sup> represents hydrogen or C<sub>1-3</sub> alkyl), etc.; R<sup>1</sup> represents optionally substituted alkyl, etc.; R<sup>2</sup> represents hydroxy, etc.; and Y represents an optionally substituted aromatic heterocycle, etc.; tautomers thereof or pharmaceutically acceptable salts thereof; and drugs such as interferon inducing agents, antiviral agents, anticancer agents, type 2 helper T cell-selective immune response inhibitors, antiallergic agents and immune response controlling agents containing the same as the active ingredient.

[続葉有]

WO 02/085905 A1

BEST AVAILABLE COPY



肇 (KAWAKAMI, Hajime) [JP/JP]; 〒662-0002 兵庫県  
西宮市 鷺林寺南町16-11 Hyogo (JP).

(74) 代理人: 平木 祐輔, 外 (HIRAKI, Yusuke et al.); 〒  
105-0001 東京都港区 虎ノ門一丁目17番1号 虎ノ門5  
森ビル 3F Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,  
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,  
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA,  
ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,  
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許  
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特  
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,  
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,  
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

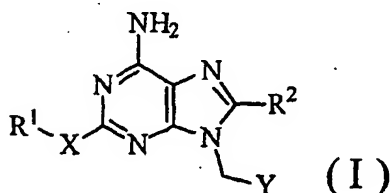
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

一般式 (I) :



〔式中、Xは、NR<sup>3</sup> (R<sup>3</sup>は水素原子若しくは炭素数1～3のアルキル基) 等を表し  
; R<sup>1</sup>は、置換若しくは非置換のアルキル基等を表し ; R<sup>2</sup>は、水酸基等を表し ; Y  
は、置換若しくは非置換の芳香族ヘテロ環等を表す。〕で示されるアデニン誘導  
体若しくはその互変異性体又はそれらの薬学的に許容される塩、及び、これを有  
効成分とする、インターフェロン誘導剤、抗ウイルス剤、抗癌剤、タイプ2ヘル  
パーT細胞選択的免疫応答抑制剤、抗アレルギー剤及び免疫応答調節剤等の医薬  
に関する。

## 明 細 書

## 新規アデニン誘導体

## 技術分野

本発明は、B型及びC型肝炎、エイズなどのウイルス疾患、癌疾患などの予防又は治療に対して有用なアデニン誘導体、並びにこれを有効成分とする、インターフェロン誘導剤、抗ウイルス剤、抗癌剤、タイプ2ヘルパーT細胞選択的免疫応答抑制剤、抗アレルギー剤及び免疫応答調節剤等の医薬に関する。

## 背景技術

インターフェロンは感染防御や免疫調節を担う最も重要な因子の一つであり、B型及びC型肝炎治療剤、或いは癌免疫療法剤として既に実用化されている。特にC型肝炎においては事実上唯一の治療薬となっている。インターフェロンは分子量約2万のポリペプチドであり、遺伝子組換え法あるいは細胞培養法によって製造され、注射によってのみが投与可能である。従って、経口投与可能なインターフェロン誘導剤が望まれている。

これまでインターフェロン誘発作用を持つ物質としては、ウイルスや他の生物由来の二本鎖核酸、ポリ（I）：ポリ（C）やポリカルボキシレートなどの高分子ポリマーが知られているが、二本鎖核酸や高分子ポリマーは、抗原性や病原微生物による汚染の危険、生物学的安定性等で問題がある上、高分子であるため経口剤としての開発は困難である。低分子インターフェロン誘導物質として、フルオレノン類、ピリミジノン類、アントラキノロン類など幾つかのものが検討されてきたが（Mayer, G. D., et al.: Science, 1970, 169, 1214, Nichol, F. R., et al.: Antimicrob. Agents Chemother., 1976, 9, 433, Stringfellow, D. A., et al.: Antimicrob. Agents Chemother., 1991, 15, 111）、治療効果が低く、或いはその毒性のため医薬品としての開発は断念されてきた（Reiter, M. A., et al.: J. Leukocyte Biol. 1994, 55, 234）。別の低分子インターフェロン誘導物質として、イミダゾキノリン誘導体であるR-837（イミキモド）も知られてい

るが (EP 145, 340)、R-837のインターフェロン誘導活性は低く、副作用のため経口剤分野での開発は中止されている。我々も特定のプリン誘導体にインターフェロン誘導作用があることを見出した (W099-28321)。しかし、これらの化合物は水溶性が低いために、消化管吸収率の点で必ずしも十分ではなかった。

一方、免疫応答において中心的役割を担っているのはヘルパーT細胞である。ヘルパーT細胞にはTh1細胞とTh2細胞の2種類があり、Th1細胞の活性化に伴い産生されるサイトカインにはインターロイキン-2 (IL-2) やインターフェロン- $\gamma$  (IFN- $\gamma$ ) などがあり、Th2細胞から産生されるものには、インターロイキン-4 (IL-4) やインターロイキン-5 (IL-5) などがある。Th1側サイトカインはマクロファージやナチュラルキラー細胞などの活性化を起こし、主にウイルス、バクテリアなどに対する感染防御などの細胞性免疫に関与していることが知られている。Th2側サイトカインはB細胞からの抗体産生などの液性免疫に関与している。特にIL-4はB細胞にIgE抗体の産生を誘導させるほか、Th2細胞の分化増殖作用を有する。IL-5は好酸球の活性化、分化増殖促進、寿命延長などの作用を有しており、アレルギー性炎症でしばしば重要な役割を果たしている。実際に喘息、アトピー性皮膚炎などTh2細胞を主体とするアレルギー性炎症の患者の患部においてはこれらのTh2側サイトカインの増加が認められている。これらの疾患の治療にはステロイド剤がしばしば使用されるが、ステロイド剤の長期投与は広範な副作用 (糖尿病、骨粗鬆症、副腎機能不全、ムーンフェイスなど) が発現してしまうことが問題である。またステロイド剤はTh1およびTh2いずれのT細胞に対しても抑制的に作用するため、Th1細胞を抑制した結果として感染症を引き起こすことがある。以上よりTh2側の免疫応答を選択的に抑制する薬剤は、感染症を起こすことなく安全なアレルギー疾患の治療薬となることが期待できる。

#### 発明の開示

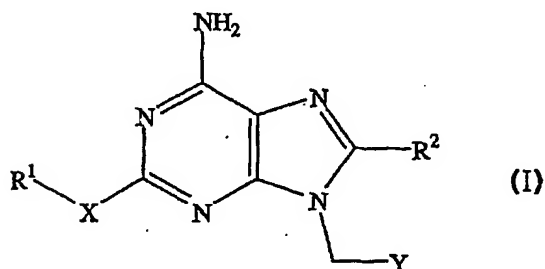
前記状況に鑑み、本発明の目的は、B型及びC型肝炎、エイズなどのウイルス疾患、癌疾患およびタイプ2-ヘルパーT細胞を起因とする疾患などの予防又は治療に対して有効で、経口投与が可能な低分子であって、さらに物性 (例えば溶解度、体内動態など) を向上させた化合物を提供することにある。



かかる背景から、本発明者らは鋭意検討した結果、特定構造を有するアデニン誘導体が、際だったインターフェロン誘導活性およびタイプ2-ヘルパーT細胞選択的免疫応答抑制作用を有するとともに、物性面で優れていることを見だし、本発明を完成するに至った。

即ち、本発明は以下の発明を包含する。

(1) 一般式 (I) :



〔式中、Xは、NR<sup>3</sup> (R<sup>3</sup>は水素原子若しくは炭素数1～3のアルキル基)、酸素原子、又は硫黄原子を表し；R<sup>1</sup>は、置換若しくは非置換のアルキル基、置換若しくは非置換のアルケニル基、置換若しくは非置換のアルキニル基、置換若しくは非置換のアリール基、又は置換若しくは非置換のヘテロアリール基を表し；R<sup>2</sup>は、水酸基、メルカプト基、炭素数1～8のアシルオキシ基、又は炭素数2～8のアルコキシカルボニルオキシ基を表し；Yは、置換若しくは非置換のナフタレン環か、置換若しくは非置換の、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む5又は6員単環芳香族ヘテロ環か、或いは、置換若しくは非置換の、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む縮合2環性芳香族ヘテロ環を表す。〕で示されるアデニン誘導体若しくはその互変異性体又はそれらの薬学的に許容される塩。

(2) 前記一般式 (I) において、R<sup>1</sup>が炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数2～8のアルキニル基、炭素数2～8のアルコキシアルキル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラールキル基、又はヘテロアリールアルキル基である前記 (1) に記載の化合物。

(3) 前記一般式 (I) において、R<sup>1</sup>が炭素数1～6のアルキル基である前記 (1)

）又は（２）に記載の化合物。

（４）前記一般式（Ⅰ）において、Xが、NHである前記（１）～（３）のいずれかに記載の化合物。

（５）前記一般式（Ⅰ）において、Xが、酸素原子である前記（１）～（３）のいずれかに記載の化合物。

（６）前記一般式（Ⅰ）において、Yが、非置換若しくは置換のピリジン環又は置換若しくは非置換のピラジン環である前記（１）～（５）のいずれかに記載の化合物。

（７）前記一般式（Ⅰ）において、Yが、非置換若しくは置換のナフタレン環又は置換若しくは非置換のチオフェン環である前記（１）～（５）のいずれかに記載の化合物。

（８）前記一般式（Ⅰ）において、Yが、炭素数１～４のアルキル基、炭素数１～４のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数１～４のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数２～８のジアルキルアミノ基、炭素数１～４のモノアルキルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基及びモルホリノ基からなる群から選択される置換基を、該Yがピリジン環の場合は１～４個、該Yがピラジン環の場合は１～３個任意の位置に有する前記（１）～（６）のいずれかに記載の化合物。

（９）前記一般式（Ⅰ）において、Yが、炭素数１～４のアルキル基、炭素数１～４のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数１～４のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数２～８のジアルキルアミノ基、炭素数１～４のモノアルキルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基及びモルホリノ基からなる群から選択される置換基を有していてもよいピリジン環であり、R<sup>1</sup>が炭素数１～６のアルキル基であり、R<sup>2</sup>が水酸基である前記（１）～（６）、（８）のいずれかに記載の化合物。

（１０）Xが NH 又は酸素原子である（９）記載の化合物。

（１１）前記（１）～（１０）のいずれかに記載の化合物を有効成分とする医薬

。（１２）前記（１）～（１０）のいずれかに記載の化合物を有効成分とするインターフェロン誘導剤。

(13) 前記(1)～(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする抗ウイルス剤。

(14) 前記(1)～(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする抗癌剤。

(15) 前記(1)～(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とするタイプ2ヘルパーT細胞選択的免疫応答抑制剤。

(16) 前記(1)～(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする抗アレルギー剤。

(17) 前記(1)～(10)のいずれかに記載の化合物を有効成分とする免疫応答調節剤。

以下、本発明の化合物について詳細に説明する。

一般式(I)において、 $R^1$ におけるアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基としては炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数2～8のアルキニル基が好ましい。さらに、 $R^1$ におけるアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基の置換基としては、水酸基、炭素数1～8のアルコキシ基、アリール基、ヘテロアリール基、ハロゲン原子(塩素、フッ素、臭素、碘素等)を挙げることができ、特に、 $R^1$ における置換のアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基としては炭素数2～8のアルコキシアルキル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、アララルキル基、及びヘテロアリールアルキル基等が好ましい。

前記炭素数1～8のアルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、1-プロピル基、2-プロピル基、1-ブチル基、2-ブチル基、1-ペンチル基、2-ペンチル基、1-ヘキシル基、2-ヘキシル基、1-ヘプチル基、2-ヘプチル基、3-ヘプチル基、オクチル基、2-メチルプロピル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、4-メチルペンチル基、メチルヘキシル基、メチルヘプチル基、1,1-ジメチルエチル基、1,1-ジメチルプロピル基、2-エチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、メチルシクロペンチル基、シクロヘキシル基、メチルシクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基などが挙げられる。

前記炭素数2～8のアルケニル基としては、例えばビニル基、アリル基、クロチル基、1-プロペニル基、シクロペンテニル基、シクロペンタジエニル基、シクロヘキセニル基などが挙げられる。

前記炭素数2～8のアルキニル基としては、例えばエチニル基、プロピニル基、ブチニル基などが挙げられる。

前記炭素数1～8のヒドロキシアルキル基としては、例えば1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロピル基、2-ヒドロキシプロピル基、3-ヒドロキシプロピル基、1-ヒドロキシブチル基、2-ヒドロキシブチル基、3-ヒドロキシブチル基、4-ヒドロキシブチル基などが挙げられる。

前記アラルキル基としては、例えばベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、フェニルプロピル基、フェニルブチル基などが挙げられる。

前記ヘテロアリールアルキル基としては、4-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基などが挙げられる。

前記炭素数2～8のアルコキシアルキル基としては、例えばメトキシメチル基、2-メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、4-メトキシブチル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、3-エトキシプロピルなどが挙げられる。

なお、上で示したR<sup>1</sup>で表される各置換基は、アルキル基、ヒドロキシ基、メルカプト基、ハロゲン原子、アミノ基、アルコキシ基等の置換基を有していてもよい。

また一般式 (I) において、R<sup>1</sup>におけるアリール基またはヘテロアリール基としては、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-ピラジニル基、3-ピラジニル基、2-ピリミジニル基、4-ピリミジニル基、5-ピリミジニル基、2-フリル基、3-フリル基、2-チエニル基、3-チエニル基などが挙げられる。上記アリール基またはヘテロアリール基は非置換あるいは置換基を有していてもよく、置換基としては炭素数1～4のアルキル基、炭素数1～4のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数1～4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数1～4のモノアルキルアミノ基、メチレンジオキシ基等が挙げられる。前記炭素数1～4のアルキル基としては、メチル基、エチル基、1-プロピル基、2-プロピル基、1-ブ

チル基、2-ブチル基などを挙げることができる。炭素数1~4のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、1-プロポキシ基、2-プロポキシ基、1-ブトキシ基、2-ブトキシ基などを挙げることができる。前記炭素数2~8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルプロピルアミノ基などを挙げることができる。前記炭素数1~4のモノアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、ブチルアミノ基などを挙げることができる。前記炭素数1~4のアルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、1-プロピルチオ基、2-プロピルチオ基、1-ブチルチオ基、2-ブチルチオ基、1-ブチルチオ基などが挙げられる。前記ハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素が挙げられる。

置換基を有するR<sup>1</sup>におけるアリール基またはヘテロアリール基としては、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-エチルフェニル基、3-エチルフェニル基、4-エチルフェニル基、2-プロピルフェニル基、3-プロピルフェニル基、4-プロピルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-ブチルフェニル基、3-ブチルフェニル基、4-ブチルフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-エトキシフェニル基、3-エトキシフェニル基、4-エトキシフェニル基、2-プロポキシフェニル基、3-プロポキシフェニル基、4-プロポキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-ブトキシフェニル基、3-ブトキシフェニル基、4-ブトキシフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、2-エチルアミノフェニル基、3-エチルアミノフェニル基、4-エチルアミノフェニル基、2-プロピルアミノフェニル基、3-プロピルアミノフェニル基、4-プロピルアミノフェニル基、2-イソプロピルアミノフェニル基、3-イソプロピルアミノフェニル基、4-イソプロピルアミノフェニル基、2-ブチルアミノフェニル基、3-ブチルアミノフェニル基、4-ブチルアミノフェニル基、2-ジメチル

アミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-ジエチルアミノフェニル基、3-ジエチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、2-ジプロピルアミノフェニル基、3-ジプロピルアミノフェニル基、4-ジプロピルアミノフェニル基、2-ジブチルアミノフェニル基、3-ジブチルアミノフェニル基、4-ジブチルアミノフェニル基、2-エチルメチルアミノフェニル基、3-エチルメチルアミノフェニル基、4-エチルメチルアミノフェニル基、2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、2-エチルチオフェニル基、3-エチルチオフェニル基、4-エチルチオフェニル基、2-プロピルチオフェニル基、3-プロピルチオフェニル基、4-プロピルチオフェニル基、2-イソプロピルチオフェニル基、3-イソプロピルチオフェニル基、4-イソプロピルチオフェニル基、2-ブチルチオフェニル基、3-ブチルチオフェニル基、4-ブチルチオフェニル基、2-メチル-1-ナフチル基、3-メチル-1-ナフチル基、4-メチル-1-ナフチル基、5-メチル-1-ナフチル基、6-メチル-1-ナフチル基、7-メチル-1-ナフチル基、8-メチル-1-ナフチル基、1-メチル-2-ナフチル基、3-メチル-2-ナフチル基、4-メチル-2-ナフチル基、5-メチル-2-ナフチル基、6-メチル-2-ナフチル基、7-メチル-2-ナフチル基、8-メチル-2-ナフチル基、2-メトキシ-1-ナフチル基、3-メトキシ-1-ナフチル基、4-メトキシ-1-ナフチル基、5-メトキシ-1-ナフチル基、6-メトキシ-1-ナフチル基、7-メトキシ-1-ナフチル基、8-メトキシ-1-ナフチル基、1-メトキシ-2-ナフチル基、3-メトキシ-2-ナフチル基、4-メトキシ-2-ナフチル基、5-メトキシ-2-ナフチル基、6-メトキシ-2-ナフチル基、7-メトキシ-2-ナフチル基、8-メトキシ-2-ナフチル基、2-エトキシ-1-ナフチル基、3-エトキシ-1-ナフチル基、4-エトキシ-1-ナフチル基、5-エトキシ-1-ナフチル基、6-エトキシ-1-ナフチル基、7-エトキシ-1-ナフチル基、8-エトキシ-1-ナフチル基、1-エトキシ-2-ナフチル基、3-エトキシ-2-ナフチル基、4-エトキシ-2-ナフチル基、5-エトキシ-2-ナフチル基、6-エトキシ-2-ナフチル基、7-エトキシ-2-ナフチル基、8-エトキシ-2-ナフチル基、2-ヒドロキシ-1-ナフチル基、3-ヒドロキシ-1-ナフチル基、4-ヒドロキシ-1-ナフチル基、5-ヒドロキシ-1-ナフチル基、6-ヒドロキシ-1-ナフチル基、7-ヒドロキシ-1-ナフチル基、8-ヒドロキシ-1-ナフチル基、1-ヒドロキシ-2-ナフチル基、3-ヒドロキシ-2-ナフチル基、4-

-ヒドロキシ-2-ナフチル基、5-ヒドロキシ-2-ナフチル基、6-ヒドロキシ-2-ナフチル基、7-ヒドロキシ-2-ナフチル基、8-ヒドロキシ-2-ナフチル基、2-クロロ-1-ナフチル基、3-クロロ-1-ナフチル基、4-クロロ-1-ナフチル基、5-クロロ-1-ナフチル基、6-クロロ-1-ナフチル基、7-クロロ-1-ナフチル基、8-クロロ-1-ナフチル基、1-クロロ-2-ナフチル基、3-クロロ-2-ナフチル基、4-クロロ-2-ナフチル基、5-クロロ-2-ナフチル基、6-クロロ-2-ナフチル基、7-クロロ-2-ナフチル基、8-クロロ-2-ナフチル基、2-フルオロ-1-ナフチル基、3-フルオロ-1-ナフチル基、4-フルオロ-1-ナフチル基、5-フルオロ-1-ナフチル基、6-フルオロ-1-ナフチル基、7-フルオロ-1-ナフチル基、8-フルオロ-1-ナフチル基、1-フルオロ-2-ナフチル基、3-フルオロ-2-ナフチル基、4-フルオロ-2-ナフチル基、5-フルオロ-2-ナフチル基、6-フルオロ-2-ナフチル基、7-フルオロ-2-ナフチル基、8-フルオロ-2-ナフチル基、2-アミノ-1-ナフチル基、3-アミノ-1-ナフチル基、4-アミノ-1-ナフチル基、5-アミノ-1-ナフチル基、6-アミノ-1-ナフチル基、7-アミノ-1-ナフチル基、8-アミノ-1-ナフチル基、1-アミノ-2-ナフチル基、3-アミノ-2-ナフチル基、4-アミノ-2-ナフチル基、5-アミノ-2-ナフチル基、6-アミノ-2-ナフチル基、7-アミノ-2-ナフチル基、8-アミノ-2-ナフチル基、2-メチルアミノ-1-ナフチル基、3-メチルアミノ-1-ナフチル基、4-メチルアミノ-1-ナフチル基、5-メチルアミノ-1-ナフチル基、6-メチルアミノ-1-ナフチル基、7-メチルアミノ-1-ナフチル基、8-メチルアミノ-1-ナフチル基、1-メチルアミノ-2-ナフチル基、3-メチルアミノ-2-ナフチル基、4-メチルアミノ-2-ナフチル基、5-メチルアミノ-2-ナフチル基、6-メチルアミノ-2-ナフチル基、7-メチルアミノ-2-ナフチル基、8-メチルアミノ-2-ナフチル基、2-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、3-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、8-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、1-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、3-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、8-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、2-メチル-3-ピリジル基、4-メチル-3-ピリジル基、5-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、3-メチル-2-ピ

リジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-メチル-2-ピリジル基、2-メチル-4-ピリジル基、3-メチル-4-ピリジル基、5-メチル-4-ピリジル基、6-メチル-4-ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、4-エチル-3-ピリジル基、5-エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-エチル-2-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル基、3-エチル-4-ピリジル基、5-エチル-4-ピリジル基、6-エチル-4-ピリジル基、2-メトキシ-3-ピリジル基、4-メトキシ-3-ピリジル基、5-メトキシ-3-ピリジル基、6-メトキシ-3-ピリジル基、3-メトキシ-2-ピリジル基、4-メトキシ-2-ピリジル基、5-メトキシ-2-ピリジル基、6-メトキシ-2-ピリジル基、2-メトキシ-4-ピリジル基、3-メトキシ-4-ピリジル基、5-メトキシ-4-ピリジル基、6-メトキシ-4-ピリジル基、2-エトキシ-3-ピリジル基、4-エトキシ-3-ピリジル基、5-エトキシ-3-ピリジル基、6-エトキシ-3-ピリジル基、3-エトキシ-2-ピリジル基、4-エトキシ-2-ピリジル基、5-エトキシ-2-ピリジル基、6-エトキシ-2-ピリジル基、2-エトキシ-4-ピリジル基、3-エトキシ-4-ピリジル基、5-エトキシ-4-ピリジル基、6-エトキシ-4-ピリジル基、2-ヒドロキシ-3-ピリジル基、4-ヒドロキシ-3-ピリジル基、5-ヒドロキシ-3-ピリジル基、6-ヒドロキシ-3-ピリジル基、3-ヒドロキシ-2-ピリジル基、4-ヒドロキシ-2-ピリジル基、5-ヒドロキシ-2-ピリジル基、6-ヒドロキシ-2-ピリジル基、2-ヒドロキシ-4-ピリジル基、3-ヒドロキシ-4-ピリジル基、5-ヒドロキシ-4-ピリジル基、6-ヒドロキシ-4-ピリジル基、2-メルカプト-3-ピリジル基、4-メルカプト-3-ピリジル基、5-メルカプト-3-ピリジル基、6-メルカプト-3-ピリジル基、3-メルカプト-2-ピリジル基、4-メルカプト-2-ピリジル基、5-メルカプト-2-ピリジル基、6-メルカプト-2-ピリジル基、2-メルカプト-4-ピリジル基、3-メルカプト-4-ピリジル基、5-メルカプト-4-ピリジル基、6-メルカプト-4-ピリジル基、2-メチルチオ-3-ピリジル基、4-メチルチオ-3-ピリジル基、5-メチルチオ-3-ピリジル基、6-メチルチオ-3-ピリジル基、3-メチルチオ-2-ピリジル基、4-メチルチオ-2-ピリジル基、5-メチルチオ-2-ピリジル基、6-メチルチオ-2-ピリジル基、2-メチルチオ-4-ピリジル基、3-メチルチオ-4-ピリジル基、5-メチルチオ-4-ピリジル基、6-メチルチオ-4-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、4-クロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-



3-ピリジル基、6-クロロ-3-ピリジル基、3-クロロ-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、5-クロロ-2-ピリジル基、6-クロロ-2-ピリジル基、2-クロロ-4-ピリジル基、3-クロロ-4-ピリジル基、5-クロロ-4-ピリジル基、6-クロロ-4-ピリジル基、2-アミノ-3-ピリジル基、4-アミノ-3-ピリジル基、5-アミノ-3-ピリジル基、6-アミノ-3-ピリジル基、3-アミノ-2-ピリジル基、4-アミノ-2-ピリジル基、5-アミノ-2-ピリジル基、6-アミノ-2-ピリジル基、2-アミノ-4-ピリジル基、3-アミノ-4-ピリジル基、5-アミノ-4-ピリジル基、6-アミノ-4-ピリジル基、2-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、4-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、5-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、6-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、3-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、4-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、5-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、6-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、2-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、3-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、5-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、6-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、2-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、4-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、5-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、3-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、4-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、5-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、2-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、3-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、5-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、2-フルオロ-3-ピリジル基、4-フルオロ-3-ピリジル基、5-フルオロ-3-ピリジル基、6-フルオロ-3-ピリジル基、3-フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、2-フルオロ-4-ピリジル基、3-フルオロ-4-ピリジル基、5-フルオロ-4-ピリジル基、6-フルオロ-4-ピリジル基、2,4-ジメチル-3-ピリジル基、2,6-ジメチル-3-ピリジル基、5,6-ジメチル-3-ピリジル基、4,6-ジメチル-3-ピリジル基、4,5-ジメチル-2-ピリジル基、5,6-ジメチル-2-ピリジル基、2,3-ジメチル-4-ピリジル基、2,6-ジメチル-4-ピリジル基、2,4-ジメトキシ-3-ピリジル基、2,6-ジメトキシ-3-ピリジル基、5,6-ジメトキシ-3-ピリジル基、4,6-ジメトキシ-3-ピリジル基、4,5-ジメトキシ-2-ピリジル基、5,6-ジメトキシ-2-ピリジル基、2,3-ジメトキシ-4-ピリジル基、2,6-ジメトキシ-4-ピリジル基、2-クロロ-6-メチル-3-ピリジル基、6-クロロ-2-メチル-3-ピリジ

ル、2-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基、6-クロロ-2-メトキシ-3-ピリジル基、5-メチル-6-クロロ-3-ピリジル基、5-メトキシ-6-クロロ-3-ピリジル基、5-エトキシ-6-クロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-6-メチル-3-ピリジル基、5-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、5-エトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、5-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基、5-クロロ-6-エトキシ-3-ピリジル基、2,5,6-トリメチル-3-ピリジル基、2-ピラジニル基、5-メチル-2-ピラジニル基、6-メチル-2-ピラジニル基、5-メトキシ-2-ピラジニル基、6-メトキシ-2-ピラジニル基、5-エトキシ-2-ピラジニル基、6-エトキシ-2-ピラジニル基、5-クロロ-2-ピラジニル基、6-クロロ-2-ピラジニル基、3-メチル-2-フリル基、4-メチル-2-フリル基、5-メチル-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、4-メチル-3-フリル基、5-メチル-3-フリル基、3-メトキシ-2-フリル基、4-メトキシ-2-フリル基、5-メトキシ-2-フリル基、2-メトキシ-3-フリル基、4-メトキシ-3-フリル基、5-メトキシ-3-フリル基、3-クロロ-2-フリル基、4-クロロ-2-フリル基、5-クロロ-2-フリル基、2-クロロ-3-フリル基、4-クロロ-3-フリル基、5-クロロ-3-フリル基、3-フルオロ-2-フリル基、4-フルオロ-2-フリル基、5-フルオロ-2-フリル基、2-フルオロ-3-フリル基、4-フルオロ-3-フリル基、5-フルオロ-3-フリル基、3-メチル-2-チエニル基、4-メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、2-メチル-3-チエニル基、4-メチル-3-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、3-メトキシ-2-チエニル基、4-メトキシ-2-チエニル基、5-メトキシ-2-チエニル基、2-メトキシ-3-チエニル基、4-メトキシ-3-チエニル基、5-メトキシ-3-チエニル基、3-クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基、2-クロロ-3-チエニル基、4-クロロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニル基、3-フルオロ-2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-チエニル基、2-フルオロ-3-チエニル基、4-フルオロ-3-チエニル基、5-フルオロ-3-チエニル基などが挙げられる。

一般式 (I) において、 $R^2$ で表される置換基としては水酸基、メルカプト基、炭素数1～8のアシルオキシ基、又は炭素数2～8のアルコキシカルボニルオキシ基等が挙げられる。

前記炭素数1～8のアシルオキシ基としては、例えばホルミルオキシ基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ブタノイルオキシ基、ペンタノイルオキ

シ基、ヘキサノイルオキシ基、ヘプタノイルオキシ基、オクタノイルオキシ基、ベンゾイルオキシ基などが挙げられる。

前記炭素数2~8のアルコキシカルボニルオキシ基としては、例えばメトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、プロポキシカルボニルオキシ基、ブトキシカルボニルオキシ基、ペンチルオキシカルボニルオキシ基、ヘキシルオキシカルボニルオキシ基、ヘプチルオキシカルボニルオキシ基、イソプロピルオキシカルボニルオキシ基、イソブチルオキシカルボニルオキシ基、*t*-ブチルオキシカルボニルオキシ基、イソペンチルオキシカルボニルオキシ基、ベンジルオキシカルボニルオキシ基などが挙げられる。

一般式 (I) において、Xとしては $\text{NR}^3$ 、酸素原子、又は硫黄原子のいずれかであるが、前記 $\text{R}^3$ は水素原子または炭素数1~3のアルキル基で、当該アルキル基としては、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基等である。

一般式 (I) Yにおける、窒素原子、酸素原子、または硫黄原子から選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む5または6員単環芳香族ヘテロ環としては、チオフェン環、フラン環、ピロール環、チアゾール環、イソオキサゾール環、オキサゾール環、ピラゾール環、イミダゾール環、ピリジン環、ピラジン環、ピリミジン環、またはピリダジン環などが挙げられ、窒素原子、酸素原子、または硫黄原子から選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含む縮合2環性芳香族ヘテロ環としては、ベンゾチオフェン環、ベンゾフラン環、インドール環、ベンゾチアゾール環、ベンゾオキサゾール環、ベンゾイミダゾール環、キノリン環、イソキノリン環などが挙げられる。上記のYは、非置換でも、また置換基によってその一部が置換されていてもよい。好ましいYとしては、ナフタレン環、チオフェン環、ピリジン環及びピラジン環が挙げられ、これらの環は非置換でも、また置換基によってその一部が置換されていてもよい。例えば当該Yがピリジン環である場合は1~4個の置換基によってピリジン環の任意の位置に置換されていてもよく、当該Yがピラジン環である場合は1~3個の置換基によってピラジン環の任意の位置に置換されていてもよい。また、当該Yが2個以上の置換基によって置換されている場合は、それぞれの置換基は互いに同一でも異なってもよい。

このYの置換基としては炭素数1~4のアルキル基、炭素数1~4のアルコキシ基

、水酸基、メルカプト基、炭素数1~4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2~8のジアルキルアミノ基、炭素数1~4のモノアルキルアミノ基、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル基、3-ピロリジニル基、ピペリジノ基、モルホリノ基、3-モルホリニル基等が挙げられる。前記炭素数1~4のアルキル基及び炭素数1~4のアルコキシ基、さらには前記炭素数2~8のジアルキルアミノ基及び炭素数1~4のモノアルキルアミノ基中のアルキル基は、先に述べたR<sup>1</sup>の場合と同様である。前記炭素数1~4のアルキルチオ基としては、メチルチオ基、エチルチオ基、1-プロピルチオ基、2-プロピルチオ基、1-ブチルチオ基、2-ブチルチオ基、1-ブチルチオ基などが挙げられる。前記ハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素が挙げられる。

置換基を有するYとしては、2-メチル-1-ナフチル基、3-メチル-1-ナフチル基、4-メチル-1-ナフチル基、5-メチル-1-ナフチル基、6-メチル-1-ナフチル基、7-メチル-1-ナフチル基、8-メチル-1-ナフチル基、1-メチル-2-ナフチル基、3-メチル-2-ナフチル基、4-メチル-2-ナフチル基、5-メチル-2-ナフチル基、6-メチル-2-ナフチル基、7-メチル-2-ナフチル基、8-メチル-2-ナフチル基、2-メトキシ-1-ナフチル基、3-メトキシ-1-ナフチル基、4-メトキシ-1-ナフチル基、5-メトキシ-1-ナフチル基、6-メトキシ-1-ナフチル基、7-メトキシ-1-ナフチル基、8-メトキシ-1-ナフチル基、1-メトキシ-2-ナフチル基、3-メトキシ-2-ナフチル基、4-メトキシ-2-ナフチル基、5-メトキシ-2-ナフチル基、6-メトキシ-2-ナフチル基、7-メトキシ-2-ナフチル基、8-メトキシ-2-ナフチル基、2-エトキシ-1-ナフチル基、3-エトキシ-1-ナフチル基、4-エトキシ-1-ナフチル基、5-エトキシ-1-ナフチル基、6-エトキシ-1-ナフチル基、7-エトキシ-1-ナフチル基、8-エトキシ-1-ナフチル基、1-エトキシ-2-ナフチル基、3-エトキシ-2-ナフチル基、4-エトキシ-2-ナフチル基、5-エトキシ-2-ナフチル基、6-エトキシ-2-ナフチル基、7-エトキシ-2-ナフチル基、8-エトキシ-2-ナフチル基、2-ヒドロキシ-1-ナフチル基、3-ヒドロキシ-1-ナフチル基、4-ヒドロキシ-1-ナフチル基、5-ヒドロキシ-1-ナフチル基、6-ヒドロキシ-1-ナフチル基、7-ヒドロキシ-1-ナフチル基、8-ヒドロキシ-1-ナフチル基、1-ヒドロキシ-2-ナフチル基、3-ヒドロキシ-2-ナフチル基、4-ヒドロキシ-2-ナフチル基、5-ヒドロキシ-2-ナフチル基、6-ヒドロキシ-

-2-ナフチル基、7-ヒドロキシ-2-ナフチル基、8-ヒドロキシ-2-ナフチル基、2-クロロ-1-ナフチル基、3-クロロ-1-ナフチル基、4-クロロ-1-ナフチル基、5-クロロ-1-ナフチル基、6-クロロ-1-ナフチル基、7-クロロ-1-ナフチル基、8-クロロ-1-ナフチル基、1-クロロ-2-ナフチル基、3-クロロ-2-ナフチル基、4-クロロ-2-ナフチル基、5-クロロ-2-ナフチル基、6-クロロ-2-ナフチル基、7-クロロ-2-ナフチル基、8-クロロ-2-ナフチル基、2-フルオロ-1-ナフチル基、3-フルオロ-1-ナフチル基、4-フルオロ-1-ナフチル基、5-フルオロ-1-ナフチル基、6-フルオロ-1-ナフチル基、7-フルオロ-1-ナフチル基、8-フルオロ-1-ナフチル基、1-フルオロ-2-ナフチル基、3-フルオロ-2-ナフチル基、4-フルオロ-2-ナフチル基、5-フルオロ-2-ナフチル基、6-フルオロ-2-ナフチル基、7-フルオロ-2-ナフチル基、8-フルオロ-2-ナフチル基、2-アミノ-1-ナフチル基、3-アミノ-1-ナフチル基、4-アミノ-1-ナフチル基、5-アミノ-1-ナフチル基、6-アミノ-1-ナフチル基、7-アミノ-1-ナフチル基、8-アミノ-1-ナフチル基、1-アミノ-2-ナフチル基、3-アミノ-2-ナフチル基、4-アミノ-2-ナフチル基、5-アミノ-2-ナフチル基、6-アミノ-2-ナフチル基、7-アミノ-2-ナフチル基、8-アミノ-2-ナフチル基、2-メチルアミノ-1-ナフチル基、3-メチルアミノ-1-ナフチル基、4-メチルアミノ-1-ナフチル基、5-メチルアミノ-1-ナフチル基、6-メチルアミノ-1-ナフチル基、7-メチルアミノ-1-ナフチル基、8-メチルアミノ-1-ナフチル基、1-メチルアミノ-2-ナフチル基、3-メチルアミノ-2-ナフチル基、4-メチルアミノ-2-ナフチル基、5-メチルアミノ-2-ナフチル基、6-メチルアミノ-2-ナフチル基、7-メチルアミノ-2-ナフチル基、8-メチルアミノ-2-ナフチル基、2-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、3-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、8-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、1-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、3-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、8-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、3-メチル-2-チエニル基、4-メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、2-メチル-3-チエニル基、4-メチル-3-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、3-メトキシ-2-チエニル基、4-メト

キシ-2-チエニル基、5-メトキシ-2-チエニル基、2-メトキシ-3-チエニル基、4-メトキシ-3-チエニル基、5-メトキシ-3-チエニル基、3-クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基、2-クロロ-3-チエニル基、4-クロロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニル基、3-フルオロ-2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-チエニル基、2-フルオロ-3-チエニル基、4-フルオロ-3-チエニル基、5-フルオロ-3-チエニル基、3-メチル-2-フリル基、4-メチル-2-フリル基、5-メチル-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、4-メチル-3-フリル基、5-メチル-3-フリル基、3-メトキシ-2-フリル基、4-メトキシ-2-フリル基、5-メトキシ-2-フリル基、2-メトキシ-3-フリル基、4-メトキシ-3-フリル基、5-メトキシ-3-フリル基、3-クロロ-2-フリル基、4-クロロ-2-フリル基、5-クロロ-2-フリル基、2-クロロ-3-フリル基、4-クロロ-3-フリル基、5-クロロ-3-フリル基、3-フルオロ-2-フリル基、4-フルオロ-2-フリル基、5-フルオロ-2-フリル基、2-フルオロ-3-フリル基、4-フルオロ-3-フリル基、5-フルオロ-3-フリル基、3-メチル-2-ピロリル基、4-メチル-2-ピロリル基、5-メチル-2-ピロリル基、2-メチル-3-ピロリル基、4-メチル-3-ピロリル基、5-メチル-3-ピロリル基、3-メトキシ-2-ピロリル基、4-メトキシ-2-ピロリル基、5-メトキシ-2-ピロリル基、2-メトキシ-3-ピロリル基、4-メトキシ-3-ピロリル基、5-メトキシ-3-ピロリル基、3-クロロ-2-ピロリル基、4-クロロ-2-ピロリル基、5-クロロ-2-ピロリル基、2-クロロ-3-ピロリル基、4-クロロ-3-ピロリル基、5-クロロ-3-ピロリル基、3-フルオロ-2-ピロリル基、4-フルオロ-2-ピロリル基、5-フルオロ-2-ピロリル基、2-フルオロ-3-ピロリル基、4-フルオロ-3-ピロリル基、5-フルオロ-3-ピロリル基、1-メチル-2-イミダゾリル基、4-メチル-2-イミダゾリル基、1-メチル-4-イミダゾリル基、2-メチル-4-イミダゾリル基、5-メチル-4-イミダゾリル基、1-メチル-5-イミダゾリル基、4-メトキシ-2-イミダゾリル基、2-メトキシ-4-イミダゾリル基、5-メトキシ-4-イミダゾリル基、4-クロロ-2-イミダゾリル基、2-クロロ-4-イミダゾリル基、5-クロロ-4-イミダゾリル基、4-フルオロ-2-イミダゾリル基、2-フルオロ-4-イミダゾリル基、5-フルオロ-4-イミダゾリル基、2-メチル-3-ピリジル基、4-メチル-3-ピリジル基、5-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メ

チル-2-ピリジル基、6-メチル-2-ピリジル基、2-メチル-4-ピリジル基、3-メチル-4-ピリジル基、5-メチル-4-ピリジル基、6-メチル-4-ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、4-エチル-3-ピリジル基、5-エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-エチル-2-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル基、3-エチル-4-ピリジル基、5-エチル-4-ピリジル基、6-エチル-4-ピリジル基、2-メトキシ-3-ピリジル基、4-メトキシ-3-ピリジル基、5-メトキシ-3-ピリジル基、6-メトキシ-3-ピリジル基、3-メトキシ-2-ピリジル基、4-メトキシ-2-ピリジル基、5-メトキシ-2-ピリジル基、6-メトキシ-2-ピリジル基、2-メトキシ-4-ピリジル基、3-メトキシ-4-ピリジル基、5-メトキシ-4-ピリジル基、6-メトキシ-4-ピリジル基、2-エトキシ-3-ピリジル基、4-エトキシ-3-ピリジル基、5-エトキシ-3-ピリジル基、6-エトキシ-3-ピリジル基、3-エトキシ-2-ピリジル基、4-エトキシ-2-ピリジル基、5-エトキシ-2-ピリジル基、6-エトキシ-2-ピリジル基、2-エトキシ-4-ピリジル基、3-エトキシ-4-ピリジル基、5-エトキシ-4-ピリジル基、6-エトキシ-4-ピリジル基、2-ヒドロキシ-3-ピリジル基、4-ヒドロキシ-3-ピリジル基、5-ヒドロキシ-3-ピリジル基、6-ヒドロキシ-3-ピリジル基、3-ヒドロキシ-2-ピリジル基、4-ヒドロキシ-2-ピリジル基、5-ヒドロキシ-2-ピリジル基、6-ヒドロキシ-2-ピリジル基、2-ヒドロキシ-4-ピリジル基、3-ヒドロキシ-4-ピリジル基、5-ヒドロキシ-4-ピリジル基、6-ヒドロキシ-4-ピリジル基、2-メルカプト-3-ピリジル基、4-メルカプト-3-ピリジル基、5-メルカプト-3-ピリジル基、6-メルカプト-3-ピリジル基、3-メルカプト-2-ピリジル基、4-メルカプト-2-ピリジル基、5-メルカプト-2-ピリジル基、6-メルカプト-2-ピリジル基、2-メルカプト-4-ピリジル基、3-メルカプト-4-ピリジル基、5-メルカプト-4-ピリジル基、6-メルカプト-4-ピリジル基、2-メチルチオ-3-ピリジル基、4-メチルチオ-3-ピリジル基、5-メチルチオ-3-ピリジル基、6-メチルチオ-3-ピリジル基、3-メチルチオ-2-ピリジル基、4-メチルチオ-2-ピリジル基、5-メチルチオ-2-ピリジル基、6-メチルチオ-2-ピリジル基、2-メチルチオ-4-ピリジル基、3-メチルチオ-4-ピリジル基、5-メチルチオ-4-ピリジル基、6-メチルチオ-4-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、4-クロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-3-ピリジル基、6-クロロ-3-ピリジル基

、3-クロロ-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、5-クロロ-2-ピリジル基、6-クロロ-2-ピリジル基、2-クロロ-4-ピリジル基、3-クロロ-4-ピリジル基、5-クロロ-4-ピリジル基、6-クロロ-4-ピリジル基、2-アミノ-3-ピリジル基、4-アミノ-3-ピリジル基、5-アミノ-3-ピリジル基、6-アミノ-3-ピリジル基、3-アミノ-2-ピリジル基、4-アミノ-2-ピリジル基、5-アミノ-2-ピリジル基、6-アミノ-2-ピリジル基、2-アミノ-4-ピリジル基、3-アミノ-4-ピリジル基、5-アミノ-4-ピリジル基、6-アミノ-4-ピリジル基、2-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、4-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、5-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、6-モノメチルアミノ-3-ピリジル基、3-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、4-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、5-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、6-モノメチルアミノ-2-ピリジル基、2-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、3-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、5-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、6-モノメチルアミノ-4-ピリジル基、2-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、4-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、5-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、3-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、4-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、5-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-2-ピリジル基、2-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、3-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、5-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-4-ピリジル基、2-(1-ピロリジニル)-3-ピリジル基、4-(1-ピロリジニル)-3-ピリジル基、5-(1-ピロリジニル)-3-ピリジル基、6-(1-ピロリジニル)-3-ピリジル基、3-(1-ピロリジニル)-2-ピリジル基、4-(1-ピロリジニル)-2-ピリジル基、5-(1-ピロリジニル)-2-ピリジル基、6-(1-ピロリジニル)-2-ピリジル基、2-(1-ピロリジニル)-4-ピリジル基、3-(1-ピロリジニル)-4-ピリジル基、5-(1-ピロリジニル)-4-ピリジル基、6-(1-ピロリジニル)-4-ピリジル基、2-ピペリジノ-3-ピリジル基、4-ピペリジノ-3-ピリジル基、5-ピペリジノ-3-ピリジル基、6-ピペリジノ-3-ピリジル基、3-ピペリジノ-2-ピリジル基、4-ピペリジノ-2-ピリジル基、5-ピペリジノ-2-ピリジル基、6-ピペリジノ-2-ピリジル基、2-ピペリジノ-4-ピリジル基、3-ピペリジノ-4-ピリジル基、5-ピペリジノ-4-ピリジル基、6-ピペリジノ-4-ピリジル基、2-モルホリノ-3-ピリジル基、4-モルホリノ-3-ピリジル基、5-モルホリノ-3-ピリジル基、6-モルホリノ-3-ピリジル基、3-モルホリノ-2-ピリ



ジル基、4-モルホリノ-2-ピリジル基、5-モルホリノ-2-ピリジル基、6-モルホリノ-2-ピリジル基、2-モルホリノ-4-ピリジル基、3-モルホリノ-4-ピリジル基、5-モルホリノ-4-ピリジル基、6-モルホリノ-4-ピリジル基、2-フルオロ-3-ピリジル基、4-フルオロ-3-ピリジル基、5-フルオロ-3-ピリジル基、6-フルオロ-3-ピリジル基、3-フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、2-フルオロ-4-ピリジル基、3-フルオロ-4-ピリジル基、5-フルオロ-4-ピリジル基、6-フルオロ-4-ピリジル基、2,4-ジメチル-3-ピリジル基、2,6-ジメチル-3-ピリジル基、5,6-ジメチル-3-ピリジル基、4,6-ジメチル-3-ピリジル基、4,5-ジメチル-2-ピリジル基、5,6-ジメチル-2-ピリジル基、2,3-ジメチル-4-ピリジル基、2,6-ジメチル-4-ピリジル基、2,4-ジメトキシ-3-ピリジル基、2,6-ジメトキシ-3-ピリジル基、5,6-ジメトキシ-3-ピリジル基、4,6-ジメトキシ-3-ピリジル基、4,5-ジメトキシ-2-ピリジル基、5,6-ジメトキシ-2-ピリジル基、2,3-ジメトキシ-4-ピリジル基、2,6-ジメトキシ-4-ピリジル基、2-クロロ-6-メチル-3-ピリジル基、6-クロロ-2-メチル-3-ピリジル基、2-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基、6-クロロ-2-メトキシ-3-ピリジル基、5-メチル-6-クロロ-3-ピリジル基、5-メトキシ-6-クロロ-3-ピリジル基、5-エトキシ-6-クロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-6-メチル-3-ピリジル基、5-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、5-エトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、5-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基、5-クロロ-6-エトキシ-3-ピリジル基、2,5,6-トリメチル-3-ピリジル基、2-ピラジニル基、5-メチル-2-ピラジニル基、6-メチル-2-ピラジニル基、5-メトキシ-2-ピラジニル基、6-メトキシ-2-ピラジニル基、5-エトキシ-2-ピラジニル基、6-エトキシ-2-ピラジニル基、5-クロロ-2-ピラジニル基、6-クロロ-2-ピラジニル基、3-メチル-2-ベンゾチエニル基、4-メチル-2-ベンゾチエニル基、5-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-メチル-2-ベンゾチエニル基、2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-メチル-3-ベンゾチエニル基、2-メチル-5-ベンゾチエニル基、3-メチル-5-ベンゾチエニル基、4-メチル-5-ベンゾチエニル基、6-メチル-5-ベンゾチエニル基、7-メチル-5-ベンゾチエニル基、3-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-2-

ベンゾチエニル基、5-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、6-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、2-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、5-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、2-メトキシ-5-ベンゾチエニル基、3-メトキシ-5-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-5-ベンゾチエニル基、6-メトキシ-5-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-5-ベンゾチエニル基、3-クロロ-2-ベンゾチエニル基、4-クロロ-2-ベンゾチエニル基、5-クロロ-2-ベンゾチエニル基、6-クロロ-2-ベンゾチエニル基、7-クロロ-2-ベンゾチエニル基、2-クロロ-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-3-ベンゾチエニル基、5-クロロ-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-3-ベンゾチエニル基、7-クロロ-3-ベンゾチエニル基、2-クロロ-5-ベンゾチエニル基、3-クロロ-5-ベンゾチエニル基、4-クロロ-5-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-ベンゾチエニル基、7-クロロ-5-ベンゾチエニル基、3-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、2-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、2-フルオロ-5-ベンゾチエニル基、3-フルオロ-5-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-5-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-5-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-5-ベンゾチエニル基、3-メチル-2-ベンゾフリル基、4-メチル-2-ベンゾフリル基、5-メチル-2-ベンゾフリル基、6-メチル-2-ベンゾフリル基、7-メチル-2-ベンゾフリル基、2-メチル-3-ベンゾフリル基、4-メチル-3-ベンゾフリル基、5-メチル-3-ベンゾフリル基、6-メチル-3-ベンゾフリル基、7-メチル-3-ベンゾフリル基、2-メチル-5-ベンゾフリル基、3-メチル-5-ベンゾフリル基、4-メチル-5-ベンゾフリル基、6-メチル-5-ベンゾフリル基、7-メチル-5-ベンゾフリル基、3-メトキシ-2-ベンゾフリル基、4-メトキシ-2-ベンゾフリル基、5-メトキシ-2-ベンゾフリル基、6-メトキシ-2-ベンゾフリル基、7-メトキシ-2-ベンゾフリル基、2-メトキシ-3-ベンゾフリル基、4-メトキシ-3-ベンゾフリル基、5-メトキシ-3-ベンゾフリル基、6-メトキシ-3-ベンゾフリル基、7-メトキシ-3-ベンゾフリル基、2-メトキシ-5-ベンゾフリル基、3-メトキシ-5-ベンゾフリル基、4-

メトキシ-5-ベンゾフリル基、6-メトキシ-5-ベンゾフリル基、7-メトキシ-5-ベンゾフリル基、3-クロロ-2-ベンゾフリル基、4-クロロ-2-ベンゾフリル基、5-クロロ-2-ベンゾフリル基、6-クロロ-2-ベンゾフリル基、7-クロロ-2-ベンゾフリル基、2-クロロ-3-ベンゾフリル基、4-クロロ-3-ベンゾフリル基、5-クロロ-3-ベンゾフリル基、6-クロロ-3-ベンゾフリル基、7-クロロ-3-ベンゾフリル基、2-クロロ-5-ベンゾフリル基、3-クロロ-5-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-ベンゾフリル基、3-フルオロ-2-ベンゾフリル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリル基、2-フルオロ-3-ベンゾフリル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリル基、6-フルオロ-3-ベンゾフリル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリル基、2-フルオロ-5-ベンゾフリル基、3-フルオロ-5-ベンゾフリル基、4-フルオロ-5-ベンゾフリル基、6-フルオロ-5-ベンゾフリル基、7-フルオロ-5-ベンゾフリル基、1-メチル-2-インドリル基、3-メチル-2-インドリル基、4-メチル-2-インドリル基、5-メチル-2-インドリル基、6-メチル-2-インドリル基、7-メチル-2-インドリル基、1-メチル-3-インドリル基、2-メチル-3-インドリル基、4-メチル-3-インドリル基、5-メチル-3-インドリル基、6-メチル-3-インドリル基、7-メチル-3-インドリル基、1-メチル-5-インドリル基、2-メチル-5-インドリル基、3-メチル-5-インドリル基、4-メチル-5-インドリル基、6-メチル-5-インドリル基、7-メチル-5-インドリル基、3-メトキシ-2-インドリル基、4-メトキシ-2-インドリル基、5-メトキシ-2-インドリル基、6-メトキシ-2-インドリル基、7-メトキシ-2-インドリル基、2-メトキシ-3-インドリル基、4-メトキシ-3-インドリル基、5-メトキシ-3-インドリル基、6-メトキシ-3-インドリル基、7-メトキシ-3-インドリル基、2-メトキシ-5-インドリル基、3-メトキシ-5-インドリル基、4-メトキシ-5-インドリル基、6-メトキシ-5-インドリル基、7-メトキシ-5-インドリル基、3-クロロ-2-インドリル基、4-クロロ-2-インドリル基、5-クロロ-2-インドリル基、6-クロロ-2-インドリル基、7-クロロ-2-インドリル基、2-クロロ-3-インドリル基、4-クロロ-3-インドリル基、5-クロロ-3-インドリル基、6-クロロ-3-インドリル基、7-クロロ-3-インドリル基、2-クロロ-5-インドリル基、3-クロロ-5-インドリル基、4-クロロ-5-インドリル基、5-クロロ-5-インドリル基、6-クロロ-5-インドリル基、7-クロロ-5-インドリル基、

ル基、4-クロロ-5-インドリル基、6-クロロ-5-インドリル基、7-クロロ-5-インドリル基、3-フルオロ-2-インドリル基、4-フルオロ-2-インドリル基、5-フルオロ-2-インドリル基、6-フルオロ-2-インドリル基、7-フルオロ-2-インドリル基、2-フルオロ-3-インドリル基、4-フルオロ-3-インドリル基、5-フルオロ-3-インドリル基、6-フルオロ-3-インドリル基、7-フルオロ-3-インドリル基、2-フルオロ-5-インドリル基、3-フルオロ-5-インドリル基、4-フルオロ-5-インドリル基、6-フルオロ-5-インドリル基、7-フルオロ-5-インドリル基、3-メチル-2-キノリル基、4-メチル-2-キノリル基、5-メチル-2-キノリル基、6-メチル-2-キノリル基、7-メチル-2-キノリル基、8-メチル-2-キノリル基、2-メチル-4-キノリル基、3-メチル-4-キノリル基、5-メチル-4-キノリル基、6-メチル-4-キノリル基、7-メチル-4-キノリル基、8-メチル-4-キノリル基、2-メチル-6-キノリル基、3-メチル-6-キノリル基、4-メチル-6-キノリル基、5-メチル-6-キノリル基、7-メチル-6-キノリル基、8-メチル-6-キノリル基、3-メトキシ-2-キノリル基、4-メトキシ-2-キノリル基、5-メトキシ-2-キノリル基、6-メトキシ-2-キノリル基、7-メトキシ-2-キノリル基、8-メトキシ-2-キノリル基、2-メトキシ-4-キノリル基、3-メトキシ-4-キノリル基、5-メトキシ-4-キノリル基、6-メトキシ-4-キノリル基、7-メトキシ-4-キノリル基、8-メトキシ-4-キノリル基、2-メトキシ-6-キノリル基、3-メトキシ-6-キノリル基、4-メトキシ-6-キノリル基、5-メトキシ-6-キノリル基、7-メトキシ-6-キノリル基、8-メトキシ-6-キノリル基、3-クロロ-2-キノリル基、4-クロロ-2-キノリル基、5-クロロ-2-キノリル基、6-クロロ-2-キノリル基、7-クロロ-2-キノリル基、8-クロロ-2-キノリル基、2-クロロ-4-キノリル基、3-クロロ-4-キノリル基、5-クロロ-4-キノリル基、6-クロロ-4-キノリル基、7-クロロ-4-キノリル基、8-クロロ-4-キノリル基、2-クロロ-6-キノリル基、3-クロロ-6-キノリル基、4-クロロ-6-キノリル基、5-クロロ-6-キノリル基、7-クロロ-6-キノリル基、8-クロロ-6-キノリル基、3-フルオロ-2-キノリル基、4-フルオロ-2-キノリル基、5-フルオロ-2-キノリル基、6-フルオロ-2-キノリル基、7-フルオロ-2-キノリル基、8-フルオロ-2-キノリル基、2-フルオロ-4-キノリル基、3-フルオロ-4-キノリル基、5-フルオロ-4-キノリル基、6-フルオロ-4-キノリル基、7-フルオロ-4-キノリル基、8-フルオロ-4-キノリル基、2-

フルオロ-6-キノリル基、3-フルオロ-6-キノリル基、4-フルオロ-6-キノリル基、5-フルオロ-6-キノリル基、7-フルオロ-6-キノリル基、8-フルオロ-6-キノリル基などが挙げられる。

前記一般式 (I) において、さらに好ましいXとしてはNHまたは酸素原子が挙げられる。特にNHが好ましい。

前記一般式 (I) においてさらに好ましいR<sup>1</sup>としては炭素数1~6個のアルキル基、炭素数2~6個のアルケニル基、炭素数2~6個のアルキニル基が挙げられ、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、2-ブチル基、ペンチル基、2-ペンチル基、ヘキシル基、2-ヘキシル基、ビニル基、プロペニル基、ブテニル基、ブチニル基、ペンテニル基などが挙げられる。中でも炭素数3~5個のアルキル基、炭素数3~5個のアルケニル基、炭素数3~5個のアルキニル基、具体的にはプロピル基、イソプロピル基、ブチル基、2-ブチル基、ペンチル基、2-ペンチル基、プロペニル基、ブテニル基、ブチニル基、ペンテニル基などが更に好ましく、特にプロピル基、ブチル基、ペンチル基が好ましい。

前記一般式 (I) においてさらに好ましいR<sup>2</sup>としては例えば水酸基、アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基、プロポキシカルボニルオキシ基、ブトキシカルボニルオキシ基などが挙げられ、特に水酸基、メトキシカルボニルオキシ基、エトキシカルボニルオキシ基が好ましい。

前記一般式 (I) においてさらに好ましいYとしては、それぞれ置換もしくは非置換の、ピリジン環 (2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル) 及びピラジン環 (2-ピラジニル、3-ピラジニル) が挙げられ、特に3-ピリジル基が好ましい。さらに好ましい置換基を有したYとしては、例えば、2-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、2-メトキシ-3-ピリジル基、6-メトキシ-3-ピリジル基、2-エトキシ-3-ピリジル基、6-エトキシ-3-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、6-クロロ-3-ピリジル基、6-ジメチルアミノ-3-ピリジル基、6-(1-ピロリジニル)-3-ピリジル基、6-ピペリジノ-3-ピリジル基、6-モルホリノ-3-ピリジル基、6-メチルチオ-3-ピリジル基、5, 6-ジメチル-3-ピリジル基、5, 6-ジメトキシ-3-ピリジル基、2, 6-ジクロロ-3-ピ

リジル基、5, 6-ジクロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-6-メトキシ-3-ピリジル基などが好ましく、中でも特に3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、6-メトキシ-3-ピリジル基、6-エトキシ-3-ピリジル基、6-クロロ-3-ピリジル基、6-(1-ピロリジニル)-3-ピリジル基、6-モルホリノ-3-ピリジル基、2-メチル-3-ピリジル基、2-メトキシ-3-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基が好ましい。

本発明に具体的に含まれる化合物としては、例えば以下の化合物が挙げられる

。

表 1

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | propyl         | OH             | 2-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 3-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 4-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |        |    |                              |
|----|--------|----|------------------------------|
| NH | propyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | propyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | propyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | propyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | propyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | propyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | propyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | propyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | propyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | propyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| NH | propyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | propyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | propyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | propyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |



| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |        |        |                              |
|----|--------|--------|------------------------------|
| NH | propyl | OCOOME | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OCOOME | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OCOOME | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OCOOME | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OCOOME | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | propyl | OCOOME | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | propyl | OCOOME | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | propyl | OCOOME | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | propyl | OCOOME | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | propyl | OCOOME | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OCOOME | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OCOOME | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OCOOME | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OCOOME | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | propyl | OCOOME | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | propyl | OCOOME | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OCOOME | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OCOOME | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | propyl | OCOOME | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | propyl | OCOOME | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOME | 2-pyrazinyl                  |
| NH | propyl | OCOOME | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OCOOME | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | propyl | OCOOME | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | propyl | OCOOME | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OCOOME | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OCOOME | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OCOOME | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | propyl | OCOOME | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 3-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-pyridyl                    |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | propyl         | OCOOEt         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |        |        |                              |
|----|--------|--------|------------------------------|
| NH | propyl | OCOOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OCOOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OCOOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | propyl | OCOOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | propyl | OCOOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | propyl | OCOOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | propyl | OCOOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OCOOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | propyl | OCOOEt | 2-pyrazinyl                  |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OCOOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OCOOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | propyl | OCOOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | propyl | OCOOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-butyl        | OH             | 2-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |         |    |                              |
|----|---------|----|------------------------------|
| NH | n-butyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-butyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-butyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-butyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-butyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | n-butyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | n-butyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | n-butyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | n-butyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | n-butyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| NH | n-butyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | n-butyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-butyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-butyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |         |        |                              |
|----|---------|--------|------------------------------|
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 2-pyrazinyl                  |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-butyl | OCOOMe | 6-chloro-2-pyrazinyl         |



| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-pyridyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |         |        |                              |
|----|---------|--------|------------------------------|
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 2-pyrazinyl                  |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-butyl | OCOOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |          |    |                              |
|----|----------|----|------------------------------|
| NH | n-pentyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-pentyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-pentyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-pentyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-pentyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | n-pentyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | n-pentyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | n-pentyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | n-pentyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| NH | n-pentyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | n-pentyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-pentyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-pentyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |          |        |                              |
|----|----------|--------|------------------------------|
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 2-pyrazinyl                  |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-pentyl | OCOOMe | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-pyridyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|    |          |        |                              |
|----|----------|--------|------------------------------|
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 2-pyrazinyl                  |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| NH | n-pentyl | OCOOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |



| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | propyl         | OH             | 2-pyridyl                    |
| O | propyl         | OH             | 3-pyridyl                    |
| O | propyl         | OH             | 4-pyridyl                    |
| O | propyl         | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | propyl         | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| O | propyl         | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| O | propyl         | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | propyl         | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | propyl         | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | propyl         | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | propyl         | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | propyl         | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | propyl         | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | propyl         | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | propyl         | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | propyl         | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |        |    |                              |
|---|--------|----|------------------------------|
| O | propyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| O | propyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| O | propyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| O | propyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| O | propyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | propyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | propyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | propyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | propyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| O | propyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| O | propyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| O | propyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| O | propyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| O | propyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| O | propyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| O | propyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| O | propyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| O | propyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| O | propyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| O | propyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| O | propyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| O | propyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | propyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| O | propyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | propyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| O | propyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| O | propyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | propyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | propyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |        |        |                              |
|---|--------|--------|------------------------------|
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | propyl | OCOOMe | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | propyl | OCOOMe | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| 0 | propyl | OCOOMe | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-methyl-4-pyridyl           |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-chloro-4-pyridyl           |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| 0 | propyl | OCOOMe | 2-pyrazinyl                  |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| 0 | propyl | OCOOMe | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| 0 | propyl | OCOOMe | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| 0 | propyl | OCOOMe | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| 0 | propyl | OCOOMe | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-pyridyl                    |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 3-pyridyl                    |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-pyridyl                    |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-methyl-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-methyl-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-methyl-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-methyl-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-chloro-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-chloro-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-chloro-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-chloro-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| 0 | propyl         | OCOEt          | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |        |        |                              |
|---|--------|--------|------------------------------|
| O | propyl | OCOOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| O | propyl | OCOOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| O | propyl | OCOOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| O | propyl | OCOOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| O | propyl | OCOOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | propyl | OCOOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | propyl | OCOOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | propyl | OCOOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | propyl | OCOOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| O | propyl | OCOOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| O | propyl | OCOOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| O | propyl | OCOOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| O | propyl | OCOOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| O | propyl | OCOOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| O | propyl | OCOOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| O | propyl | OCOOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| O | propyl | OCOOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| O | propyl | OCOOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| O | propyl | OCOOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| O | propyl | OCOOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| O | propyl | OCOOEt | 2-pyrazinyl                  |
| O | propyl | OCOOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | propyl | OCOOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| O | propyl | OCOOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | propyl | OCOOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| O | propyl | OCOOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| O | propyl | OCOOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | propyl | OCOOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | propyl | OCOOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-butyl        | OH             | 2-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 3-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 4-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |         |    |                              |
|---|---------|----|------------------------------|
| O | n-butyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-butyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-butyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-butyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-butyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | n-butyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | n-butyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | n-butyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | n-butyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| O | n-butyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| O | n-butyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| O | n-butyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| O | n-butyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| O | n-butyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| O | n-butyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| O | n-butyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| O | n-butyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| O | n-butyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| O | n-butyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| O | n-butyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| O | n-butyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| O | n-butyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | n-butyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| O | n-butyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | n-butyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| O | n-butyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| O | n-butyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | n-butyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | n-butyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |



| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |         |        |                              |
|---|---------|--------|------------------------------|
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-methyl-4-pyridyl           |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-chloro-4-pyridyl           |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 2-pyrazinyl                  |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| 0 | n-butyl | OCOOMe | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-pyridyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |         |       |                              |
|---|---------|-------|------------------------------|
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 2-pyrazinyl                  |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| 0 | n-butyl | OCOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-pentyl       | OH             | 2-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |          |    |                              |
|---|----------|----|------------------------------|
| Q | n-pentyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-pentyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-pentyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-pentyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-pentyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | n-pentyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | n-pentyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | n-pentyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | n-pentyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| O | n-pentyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| O | n-pentyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| O | n-pentyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| O | n-pentyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| O | n-pentyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| O | n-pentyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| O | n-pentyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| O | n-pentyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| O | n-pentyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| O | n-pentyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| O | n-pentyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| O | n-pentyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | n-pentyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| O | n-pentyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | n-pentyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| O | n-pentyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| O | n-pentyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | n-pentyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | n-pentyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |          |        |                              |
|---|----------|--------|------------------------------|
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-methyl-4-pyridyl           |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-chloro-4-pyridyl           |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 2-pyrazinyl                  |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| O | n-pentyl | OCOOMe | 6-chloro-2-pyrazinyl         |



| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 3-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-pyridyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| O | n-pentyl       | OCOEt          | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |          |        |                              |
|---|----------|--------|------------------------------|
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 2-pyrazinyl                  |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| 0 | n-pentyl | OCOOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sub>1</sub> | R <sub>2</sub> | - Y                          |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | propyl         | OH             | 2-pyridyl                    |
| S | propyl         | OH             | 3-pyridyl                    |
| S | propyl         | OH             | 4-pyridyl                    |
| S | propyl         | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |        |    |                              |
|---|--------|----|------------------------------|
| S | propyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | propyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | propyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | propyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | propyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | propyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | propyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | propyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | propyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | propyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | propyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | propyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | propyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | propyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | propyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | propyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | propyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| S | propyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | propyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | propyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | propyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sub>1</sub> | R <sub>2</sub> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |        |        |                              |
|---|--------|--------|------------------------------|
| S | propyl | OCOOMe | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OCOOMe | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OCOOMe | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OCOOMe | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OCOOMe | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | propyl | OCOOMe | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | propyl | OCOOMe | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | propyl | OCOOMe | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | propyl | OCOOMe | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | propyl | OCOOMe | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | propyl | OCOOMe | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | propyl | OCOOMe | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | propyl | OCOOMe | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | propyl | OCOOMe | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | propyl | OCOOMe | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | propyl | OCOOMe | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | propyl | OCOOMe | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | propyl | OCOOMe | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | propyl | OCOOMe | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | propyl | OCOOMe | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | propyl | OCOOMe | 2-pyrazinyl                  |
| S | propyl | OCOOMe | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OCOOMe | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | propyl | OCOOMe | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | propyl | OCOOMe | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OCOOMe | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OCOOMe | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OCOOMe | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | propyl | OCOOMe | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sub>1</sub> | R <sub>2</sub> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | propyl         | OCOEt          | 2-pyridyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-pyridyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-pyridyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |        |       |                              |
|---|--------|-------|------------------------------|
| S | propyl | OCOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OCOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OCOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OCOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | propyl | OCOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | propyl | OCOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | propyl | OCOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | propyl | OCOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | propyl | OCOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | propyl | OCOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | propyl | OCOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | propyl | OCOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | propyl | OCOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | propyl | OCOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | propyl | OCOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | propyl | OCOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | propyl | OCOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | propyl | OCOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | propyl | OCOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | propyl | OCOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | propyl | OCOEt | 2-pyrazinyl                  |
| S | propyl | OCOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OCOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | propyl | OCOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | propyl | OCOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OCOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OCOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | propyl | OCOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | propyl | OCOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |



| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-butyl        | OH             | 2-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 3-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 4-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |         |    |                              |
|---|---------|----|------------------------------|
| S | n-butyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-butyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-butyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-butyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-butyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | n-butyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | n-butyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | n-butyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | n-butyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | n-butyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| S | n-butyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | n-butyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-butyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-butyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |         |        |                              |
|---|---------|--------|------------------------------|
| S | n-butyl | OCOOME | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OCOOME | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OCOOME | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-butyl | OCOOME | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-butyl | OCOOME | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-butyl | OCOOME | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-butyl | OCOOME | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OCOOME | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOOME | 2-pyrazinyl                  |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OCOOME | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OCOOME | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OCOOME | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-butyl | OCOOME | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 3-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-pyridyl                    |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-butyl        | OCOEt          | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |         |       |                              |
|---|---------|-------|------------------------------|
| S | n-butyl | OCOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OCOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OCOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-butyl | OCOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-butyl | OCOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-butyl | OCOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-butyl | OCOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OCOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | n-butyl | OCOEt | 2-pyrazinyl                  |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OCOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OCOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-butyl | OCOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-butyl | OCOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-pentyl       | OH             | 2-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |          |    |                              |
|---|----------|----|------------------------------|
| S | n-pentyl | OH | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OH | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OH | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OH | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OH | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-pentyl | OH | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-pentyl | OH | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-pentyl | OH | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-pentyl | OH | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | n-pentyl | OH | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OH | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OH | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OH | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OH | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | n-pentyl | OH | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | n-pentyl | OH | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OH | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OH | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | n-pentyl | OH | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | n-pentyl | OH | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OH | 2-pyrazinyl                  |
| S | n-pentyl | OH | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OH | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | n-pentyl | OH | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-pentyl | OH | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OH | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OH | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OH | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-pentyl | OH | 6-chloro-2-pyrazinyl         |



| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |          |        |                              |
|---|----------|--------|------------------------------|
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 2-pyrazinyl                  |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-pentyl | OCOOMe | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-pyridyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-fluoro-3-pyridyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-hydroxy-3-pyridyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-hydroxy-3-pyridyl          |

|   |          |       |                              |
|---|----------|-------|------------------------------|
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OCOEt | 4-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OCOEt | 6-mercapto-3-pyridyl         |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 4-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5,6-diethyl-3-pyridyl        |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5,6-diethoxy-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-chloro-6-methoxy-3-pyridyl |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-chloro-6-ethoxy-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-chloro-6-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OCOEt | 6-chloro-2-methyl-3-pyridyl  |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-methyl-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-ethyl-4-pyridyl            |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-methoxy-4-pyridyl          |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-ethoxy-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-chloro-4-pyridyl           |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-dimethylamino-4-pyridyl    |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-(1-pyrrolidinyl)-4-pyridyl |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-piperidino-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-morpholino-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-methylthio-4-pyridyl       |
| S | n-pentyl | OCOEt | 2-pyrazinyl                  |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-ethyl-2-pyrazinyl          |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-ethoxy-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OCOEt | 5-chloro-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OCOEt | 6-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | n-pentyl | OCOEt | 6-methoxy-2-pyrazinyl        |
| S | n-pentyl | OCOEt | 6-chloro-2-pyrazinyl         |

| X  | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|-----------------|----------------|------------------------------|
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 3-pyridyl                    |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 4-pyridyl                    |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 2-pyrazinyl                  |
| NH | 2-methoxyethyl  | OH             | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 3-pyridyl                    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-pyridyl                    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-pyrazinyl                  |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-methyl-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|-----------------|----------------|------------------------------|
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 3-pyridyl                    |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 4-pyridyl                    |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 2-pyrazinyl                  |
| O | 2-methoxyethyl  | OH             | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 3-pyridyl                    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-pyridyl                    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-pyrazinyl                  |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-methyl-2-pyrazinyl         |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 3-pyridyl                    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-pyridyl                    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-pyrazinyl                  |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methyl-2-pyrazinyl         |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 3-pyridyl                    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-pyridyl                    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-methyl-3-pyridyl           |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-methyl-3-pyridyl           |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-ethyl-3-pyridyl            |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-ethyl-3-pyridyl            |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-methoxy-3-pyridyl          |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-methoxy-3-pyridyl          |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-ethoxy-3-pyridyl           |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-chloro-3-pyridyl           |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-chloro-3-pyridyl           |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5,6-dimethyl-3-pyridyl       |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5,6-dimethoxy-3-pyridyl      |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5,6-dichloro-3-pyridyl       |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-dimethylamino-3-pyridyl    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-(1-pyrrolidinyl)-3-pyridyl |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-piperidino-3-pyridyl       |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-morpholino-3-pyridyl       |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-methylthio-3-pyridyl       |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-pyrazinyl                  |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-methyl-2-pyrazinyl         |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | propyl         | OH             | 1-naphthyl                   |
| NH | propyl         | OH             | 2-naphthyl                   |
| NH | propyl         | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| NH | propyl         | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| NH | propyl         | OH             | 2-furyl                      |
| NH | propyl         | OH             | 3-furyl                      |
| NH | propyl         | OH             | 2-thienyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 3-thienyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| NH | propyl         | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| NH | propyl         | OH             | 2-imidazolyl                 |
| NH | propyl         | OH             | 4-imidazolyl                 |
| NH | propyl         | OH             | 2-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OH             | 4-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OH             | 5-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OH             | 2-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OH             | 4-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OH             | 5-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OH             | 2-indolyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 3-indolyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 5-indolyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 6-indolyl                    |
| NH | propyl         | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| NH | propyl         | OH             | 2-benzofuryl                 |
| NH | propyl         | OH             | 3-indazolyl                  |
| NH | propyl         | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| NH | propyl         | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | propyl         | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | propyl         | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | propyl         | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | propyl         | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | propyl         | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | propyl         | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | propyl         | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | propyl         | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | propyl         | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | propyl         | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | propyl         | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | propyl         | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | propyl         | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | propyl         | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |



| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | propyl         | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | propyl         | OCOEt          | 1-naphthyl                   |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-naphthyl                   |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-pyrrolyl                   |
| NH | propyl         | OCOEt          | 3-pyrrolyl                   |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-furyl                      |
| NH | propyl         | OCOEt          | 3-furyl                      |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-thienyl                    |
| NH | propyl         | OCOEt          | 3-thienyl                    |
| NH | propyl         | OCOEt          | 3-pyrazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOEt          | 4-pyrazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-imidazolyl                 |
| NH | propyl         | OCOEt          | 4-imidazolyl                 |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OCOEt          | 4-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-oxazolyl                   |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOEt          | 4-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-thiazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OCOEt          | 4-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-pyrimidinyl                |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-indolyl                    |
| NH | propyl         | OCOEt          | 3-indolyl                    |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-indolyl                    |
| NH | propyl         | OCOEt          | 6-indolyl                    |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-benzimidazolyl             |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-benzofuryl                 |
| NH | propyl         | OCOEt          | 3-indazolyl                  |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-benzoxazolyl               |
| NH | propyl         | OCOEt          | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | propyl         | OCOEt          | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | propyl         | OCOEt          | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | propyl         | OCOEt          | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | propyl         | OCOEt          | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | propyl         | OCOEt          | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | propyl         | OCOEt          | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | propyl         | OCOEt          | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | propyl         | OCOEt          | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | propyl         | OCOEt          | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-butyl        | OH             | 1-naphthyl                   |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-naphthyl                   |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-furyl                      |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-furyl                      |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-thienyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-thienyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-imidazolyl                 |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-imidazolyl                 |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-benzofuryl                 |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-indazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | n-butyl        | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | n-butyl        | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | n-butyl        | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | n-butyl        | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | n-butyl        | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | n-butyl        | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 1-naphthyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-naphthyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-pyrrolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-pyrrolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-furyl                      |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-furyl                      |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-thienyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-thienyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-pyrazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-pyrazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-imidazolyl                 |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-imidazolyl                 |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-oxazolyl                   |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-thiazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-pyrimidinyl                |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-indolyl                    |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-benzimidazolyl             |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-benzofuryl                 |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-indazolyl                  |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-benzoxazolyl               |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | n-butyl        | OCOEt          | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-pentyl       | OH             | 1-naphthyl                   |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-naphthyl                   |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-furyl                      |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-furyl                      |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-thienyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-thienyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-imidazolyl                 |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-imidazolyl                 |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-benzofuryl                 |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-indazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | n-pentyl       | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | n-pentyl       | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | n-pentyl       | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | n-pentyl       | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | n-pentyl       | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 1-naphthyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-naphthyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-pyrrolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-pyrrolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-furyl                      |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-furyl                      |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-thienyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-thienyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-pyrazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-pyrazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-imidazolyl                 |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-imidazolyl                 |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-oxazolyl                   |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-thiazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-pyrimidinyl                |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-indolyl                    |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-benzimidazolyl             |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-benzofuryl                 |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-indazolyl                  |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-benzoxazolyl               |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |



| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | propyl         | OH             | 1-naphthyl                   |
| O | propyl         | OH             | 2-naphthyl                   |
| O | propyl         | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| O | propyl         | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| O | propyl         | OH             | 2-furyl                      |
| O | propyl         | OH             | 3-furyl                      |
| O | propyl         | OH             | 2-thienyl                    |
| O | propyl         | OH             | 3-thienyl                    |
| O | propyl         | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| O | propyl         | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| O | propyl         | OH             | 2-imidazolyl                 |
| O | propyl         | OH             | 4-imidazolyl                 |
| O | propyl         | OH             | 2-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OH             | 4-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OH             | 5-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OH             | 2-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OH             | 4-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OH             | 5-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OH             | 2-indolyl                    |
| O | propyl         | OH             | 3-indolyl                    |
| O | propyl         | OH             | 5-indolyl                    |
| O | propyl         | OH             | 6-indolyl                    |
| O | propyl         | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| O | propyl         | OH             | 2-benzofuryl                 |
| O | propyl         | OH             | 3-indazolyl                  |
| O | propyl         | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| O | propyl         | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | propyl         | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | propyl         | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | propyl         | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | propyl         | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| O | propyl         | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | propyl         | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | propyl         | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | propyl         | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | propyl         | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | propyl         | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | propyl         | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | propyl         | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | propyl         | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | propyl         | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | propyl         | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | propyl         | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | propyl         | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | propyl         | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | propyl         | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | propyl         | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | propyl         | OCOOEt         | 1-naphthyl                   |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-naphthyl                   |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-pyrrolyl                   |
| O | propyl         | OCOOEt         | 3-pyrrolyl                   |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-furyl                      |
| O | propyl         | OCOOEt         | 3-furyl                      |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-thienyl                    |
| O | propyl         | OCOOEt         | 3-thienyl                    |
| O | propyl         | OCOOEt         | 3-pyrazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOEt         | 4-pyrazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-imidazolyl                 |
| O | propyl         | OCOOEt         | 4-imidazolyl                 |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OCOOEt         | 4-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-oxazolyl                   |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOEt         | 4-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-thiazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OCOOEt         | 4-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-pyrimidinyl                |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-indolyl                    |
| O | propyl         | OCOOEt         | 3-indolyl                    |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-indolyl                    |
| O | propyl         | OCOOEt         | 6-indolyl                    |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-benzimidazolyl             |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-benzofuryl                 |
| O | propyl         | OCOOEt         | 3-indazolyl                  |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-benzoxazolyl               |
| O | propyl         | OCOOEt         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | propyl         | OCOOEt         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | propyl         | OCOOEt         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-methyl-3-furyl             |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | propyl         | OCOOEt         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | propyl         | OCOOEt         | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | propyl         | OCOOEt         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | propyl         | OCOOEt         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | propyl         | OCOOEt         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | propyl         | OCOOEt         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | propyl         | OCOOEt         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-butyl        | OH             | 1-naphthyl                   |
| O | n-butyl        | OH             | 2-naphthyl                   |
| O | n-butyl        | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| O | n-butyl        | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| O | n-butyl        | OH             | 2-furyl                      |
| O | n-butyl        | OH             | 3-furyl                      |
| O | n-butyl        | OH             | 2-thienyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 3-thienyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| O | n-butyl        | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| O | n-butyl        | OH             | 2-imidazolyl                 |
| O | n-butyl        | OH             | 4-imidazolyl                 |
| O | n-butyl        | OH             | 2-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OH             | 4-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OH             | 5-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OH             | 2-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OH             | 4-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OH             | 5-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OH             | 2-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 3-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 5-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 6-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| O | n-butyl        | OH             | 2-benzofuryl                 |
| O | n-butyl        | OH             | 3-indazolyl                  |
| O | n-butyl        | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| O | n-butyl        | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| O | n-butyl        | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | n-butyl        | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | n-butyl        | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | n-butyl        | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | n-butyl        | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | n-butyl        | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | n-butyl        | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-butyl        | OCOEt          | 1-naphthyl                   |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-naphthyl                   |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-pyrrolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-pyrrolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-furyl                      |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-furyl                      |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-thienyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-thienyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-pyrazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-pyrazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-imidazolyl                 |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-imidazolyl                 |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-oxazolyl                   |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-thiazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-pyrimidinyl                |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-indolyl                    |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-benzimidazolyl             |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-benzofuryl                 |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-indazolyl                  |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-benzoxazolyl               |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-methyl-3-furyl             |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | n-butyl        | OCOEt          | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-pentyl       | OH             | 1-naphthyl                   |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-naphthyl                   |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-furyl                      |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-furyl                      |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-thienyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-thienyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-imidazolyl                 |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-imidazolyl                 |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-benzofuryl                 |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-indazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | n-pentyl       | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | n-pentyl       | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | n-pentyl       | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | n-pentyl       | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | n-pentyl       | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | n-pentyl       | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |



| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 1-naphthyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-naphthyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-pyrrolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-pyrrolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-furyl                      |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-furyl                      |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-thienyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-thienyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-pyrazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-pyrazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-imidazolyl                 |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-imidazolyl                 |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-oxazolyl                   |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-thiazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-pyrimidinyl                |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-indolyl                    |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-benzimidazolyl             |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-benzofuryl                 |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-indazolyl                  |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-benzoxazolyl               |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-methyl-3-furyl             |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | n-pentyl       | OCOOEt         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | propyl         | OH             | 1-naphthyl                   |
| S | propyl         | OH             | 2-naphthyl                   |
| S | propyl         | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| S | propyl         | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| S | propyl         | OH             | 2-furyl                      |
| S | propyl         | OH             | 3-furyl                      |
| S | propyl         | OH             | 2-thienyl                    |
| S | propyl         | OH             | 3-thienyl                    |
| S | propyl         | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| S | propyl         | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| S | propyl         | OH             | 2-imidazolyl                 |
| S | propyl         | OH             | 4-imidazolyl                 |
| S | propyl         | OH             | 2-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OH             | 4-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OH             | 5-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OH             | 2-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OH             | 4-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OH             | 5-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OH             | 2-indolyl                    |
| S | propyl         | OH             | 3-indolyl                    |
| S | propyl         | OH             | 5-indolyl                    |
| S | propyl         | OH             | 6-indolyl                    |
| S | propyl         | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| S | propyl         | OH             | 2-benzofuryl                 |
| S | propyl         | OH             | 3-indazolyl                  |
| S | propyl         | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| S | propyl         | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | propyl         | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | propyl         | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | propyl         | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | propyl         | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| S | propyl         | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | propyl         | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | propyl         | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | propyl         | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | propyl         | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | propyl         | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | propyl         | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | propyl         | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | propyl         | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | propyl         | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | propyl         | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | propyl         | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | propyl         | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | propyl         | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | propyl         | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | propyl         | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | propyl         | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | propyl         | OCOEt          | 1-naphthyl                   |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-naphthyl                   |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-pyrrolyl                   |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-pyrrolyl                   |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-furyl                      |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-furyl                      |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-thienyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-thienyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-pyrazolyl                  |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-pyrazolyl                  |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-imidazolyl                 |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-imidazolyl                 |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-oxazolyl                   |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-thiazolyl                  |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-pyrimidinyl                |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-indolyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-indolyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-indolyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-indolyl                    |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-benzimidazolyl             |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-benzofuryl                 |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-indazolyl                  |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-benzoxazolyl               |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-methyl-3-furyl             |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | propyl         | OCOEt          | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | propyl         | OCOEt          | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | propyl         | OCOEt          | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | propyl         | OCOEt          | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | propyl         | OCOEt          | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | propyl         | OCOEt          | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | propyl         | OCOEt          | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-butyl        | OH             | 1-naphthyl                   |
| S | n-butyl        | OH             | 2-naphthyl                   |
| S | n-butyl        | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| S | n-butyl        | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| S | n-butyl        | OH             | 2-furyl                      |
| S | n-butyl        | OH             | 3-furyl                      |
| S | n-butyl        | OH             | 2-thienyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 3-thienyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| S | n-butyl        | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| S | n-butyl        | OH             | 2-imidazolyl                 |
| S | n-butyl        | OH             | 4-imidazolyl                 |
| S | n-butyl        | OH             | 2-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OH             | 4-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OH             | 5-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OH             | 2-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OH             | 4-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OH             | 5-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OH             | 2-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 3-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 5-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 6-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| S | n-butyl        | OH             | 2-benzofuryl                 |
| S | n-butyl        | OH             | 3-indazolyl                  |
| S | n-butyl        | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| S | n-butyl        | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| S | n-butyl        | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | n-butyl        | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | n-butyl        | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | n-butyl        | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | n-butyl        | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | n-butyl        | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | n-butyl        | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | n-butyl        | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | n-butyl        | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 1-naphthyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-naphthyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-pyrrolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 3-pyrrolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-furyl                      |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 3-furyl                      |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-thienyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 3-thienyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 3-pyrazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 4-pyrazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-imidazolyl                 |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 4-imidazolyl                 |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 4-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-oxazolyl                   |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 4-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-thiazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 4-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-pyrimidinyl                |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 3-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 6-indolyl                    |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-benzimidazolyl             |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-benzofuryl                 |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 3-indazolyl                  |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-benzoxazolyl               |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-methyl-3-furyl             |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | n-butyl        | OCOOEt         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-pentyl       | OH             | 1-naphthyl                   |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-naphthyl                   |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-furyl                      |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-furyl                      |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-thienyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-thienyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-imidazolyl                 |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-imidazolyl                 |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-benzofuryl                 |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-indazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | n-pentyl       | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | n-pentyl       | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | n-pentyl       | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | n-pentyl       | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | n-pentyl       | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | n-pentyl       | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | n-pentyl       | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |



| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-naphthyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-naphthyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyrrolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyrrolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-furyl                      |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-furyl                      |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-thienyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-thienyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-pyrazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyrazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-imidazolyl                 |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-imidazolyl                 |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-benzimidazolyl             |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-benzofuryl                 |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-indazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-benzoxazolyl               |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methyl-3-furyl             |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | n-pentyl       | OCOOMe         | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 1-naphthyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-naphthyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-pyrrolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 3-pyrrolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-furyl                      |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 3-furyl                      |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-thienyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 3-thienyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 3-pyrazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 4-pyrazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-imidazolyl                 |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 4-imidazolyl                 |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 4-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-oxazolyl                   |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 4-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-thiazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 4-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-pyrimidinyl                |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 3-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 6-indolyl                    |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-benzimidazolyl             |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-benzofuryl                 |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 3-indazolyl                  |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-benzoxazolyl               |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-methyl-3-furyl             |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | n-pentyl       | OCOEt          | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|----------------|----------------|------------------------------|
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 1-naphthyl                   |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-naphthyl                   |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-furyl                      |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 3-furyl                      |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-thienyl                    |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 3-thienyl                    |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-imidazolyl                 |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 4-imidazolyl                 |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-oxazolyl                   |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 4-oxazolyl                   |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-oxazolyl                   |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-thiazolyl                  |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 4-thiazolyl                  |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-thiazolyl                  |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-indolyl                    |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 3-indolyl                    |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-indolyl                    |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 6-indolyl                    |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-benzofuryl                 |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 3-indazolyl                  |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X  | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | Y                            |
|----|-----------------|----------------|------------------------------|
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 1-naphthyl                   |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-naphthyl                   |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-furyl                      |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 3-furyl                      |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-thienyl                    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 3-thienyl                    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-imidazolyl                 |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-imidazolyl                 |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-oxazolyl                   |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-oxazolyl                   |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-oxazolyl                   |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-thiazolyl                  |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-thiazolyl                  |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-thiazolyl                  |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-indolyl                    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 3-indolyl                    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-indolyl                    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-indolyl                    |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-benzofuryl                 |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 3-indazolyl                  |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| NH | 3-methoxypropyl | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 1-naphthyl                   |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-naphthyl                   |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-furyl                      |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 3-furyl                      |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-thienyl                    |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 3-thienyl                    |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-imidazolyl                 |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 4-imidazolyl                 |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-oxazolyl                   |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 4-oxazolyl                   |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-oxazolyl                   |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-thiazolyl                  |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 4-thiazolyl                  |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-thiazolyl                  |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-indolyl                    |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 3-indolyl                    |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-indolyl                    |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 6-indolyl                    |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-benzofuryl                 |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 3-indazolyl                  |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

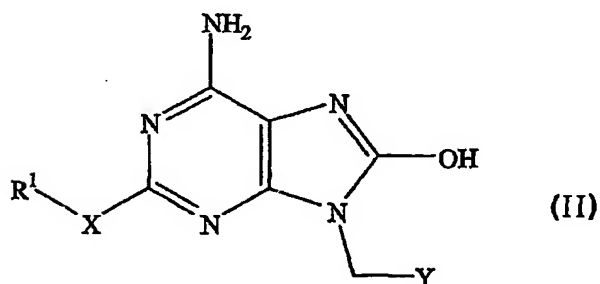
| X | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|-----------------|----------------|------------------------------|
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 1-naphthyl                   |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-naphthyl                   |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-furyl                      |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 3-furyl                      |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-thienyl                    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 3-thienyl                    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-imidazolyl                 |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-imidazolyl                 |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-oxazolyl                   |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-oxazolyl                   |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-oxazolyl                   |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-thiazolyl                  |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-thiazolyl                  |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-thiazolyl                  |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-indolyl                    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 3-indolyl                    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-indolyl                    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-indolyl                    |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-benzofuryl                 |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 3-indazolyl                  |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| O | 3-methoxypropyl | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 1-naphthyl                   |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-naphthyl                   |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-furyl                      |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 3-furyl                      |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-thienyl                    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 3-thienyl                    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-imidazolyl                 |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-imidazolyl                 |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-oxazolyl                   |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-oxazolyl                   |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-oxazolyl                   |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-thiazolyl                  |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-thiazolyl                  |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-thiazolyl                  |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-indolyl                    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 3-indolyl                    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-indolyl                    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-indolyl                    |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-benzofuryl                 |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 3-indazolyl                  |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | 2-methoxyethyl | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |

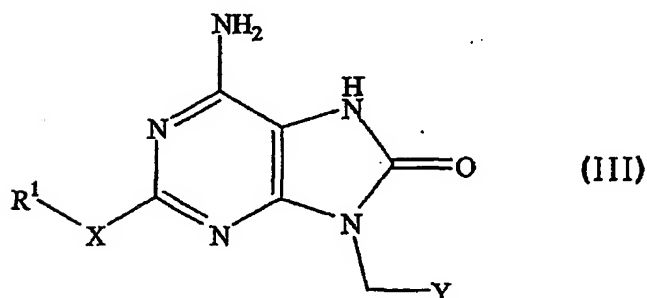
| X | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | Y                            |
|---|----------------|----------------|------------------------------|
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 1-naphthyl                   |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-naphthyl                   |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-pyrrolyl                   |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 3-pyrrolyl                   |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-furyl                      |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 3-furyl                      |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-thienyl                    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 3-thienyl                    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 3-pyrazolyl                  |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-pyrazolyl                  |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-imidazolyl                 |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-imidazolyl                 |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-oxazolyl                   |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-oxazolyl                   |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-oxazolyl                   |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-thiazolyl                  |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-thiazolyl                  |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-thiazolyl                  |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-pyrimidinyl                |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-pyrimidinyl                |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-pyrimidinyl                |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-indolyl                    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 3-indolyl                    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-indolyl                    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-indolyl                    |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-benzimidazolyl             |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-benzofuryl                 |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 3-indazolyl                  |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-benzoxazolyl               |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-fluoro-1-naphthyl          |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-chloro-2-thienyl           |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-methyl-1-naphthyl          |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 1-methyl-2-pyrrolyl          |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-methyl-3-furyl             |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-methyl-2-thienyl           |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 4-methyl-5-imidazolyl        |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 1-methyl-3-indolyl           |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 2-methoxy-1-naphthyl         |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 3-methoxy-2-naphthyl         |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 6-ethoxy-2-naphthyl          |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-methoxy-3-indolyl          |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 1,4-dimethoxy-2-naphthyl     |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5,6-dimethoxy-2-indolyl      |
| S | 2-hydroxyethyl | OH             | 5-methoxy-1-methyl-2-indolyl |



本発明の化合物において、 $R^2$ がアシルオキシ基又はアルコキシカルボニルオキシ基である化合物は、 $R^2$ が水酸基である化合物のエステルに相当し、 $R^2$ が水酸基である化合物の溶解性、吸収性、体内安定性の向上を目的としたプロドラッグである。即ち、該エステルの生体内で代謝を受け、活性本体である $R^2$ が水酸基である化合物となる。一般式（I）で示される化合物とその互変異性体は化学的に等価であり、本発明のアデニン誘導体はその互変異性体も含む。例えば、 $R^2$ が水酸基の場合、一般式（I）で示される化合物は一般式（II）：



（式中、 $R^1$ 、 $X$ 、 $Y$ は前記式（I）と同義である）のヒドロキシ誘導体となるが、該誘導体の互変異性体として下記一般式（III）：



（式中、 $R^1$ 、 $X$ 、 $Y$ は前記式（I）と同義である）のオキソ誘導体がある。

これらのアデニン誘導体の製法の一例を以下に詳述する。

（1） $R^2 = OH$ の場合

化合物（IV）と $Y-CH_2-Hal$ （式中、 $Y$ は式（II）と同義で、 $Hal$ はハロゲン原子を

表す。)とを塩基存在下に反応させて9-置換体 (V) を合成する。前記塩基としては、例えば炭酸カリウム等の炭酸のアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム等の金属水素化物、*t*-ブトキシカリウム等のアルコキシド等を用いることができる。前記溶媒としてはジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等の非プロトン性溶媒を用いることができ、反応温度は室温から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。

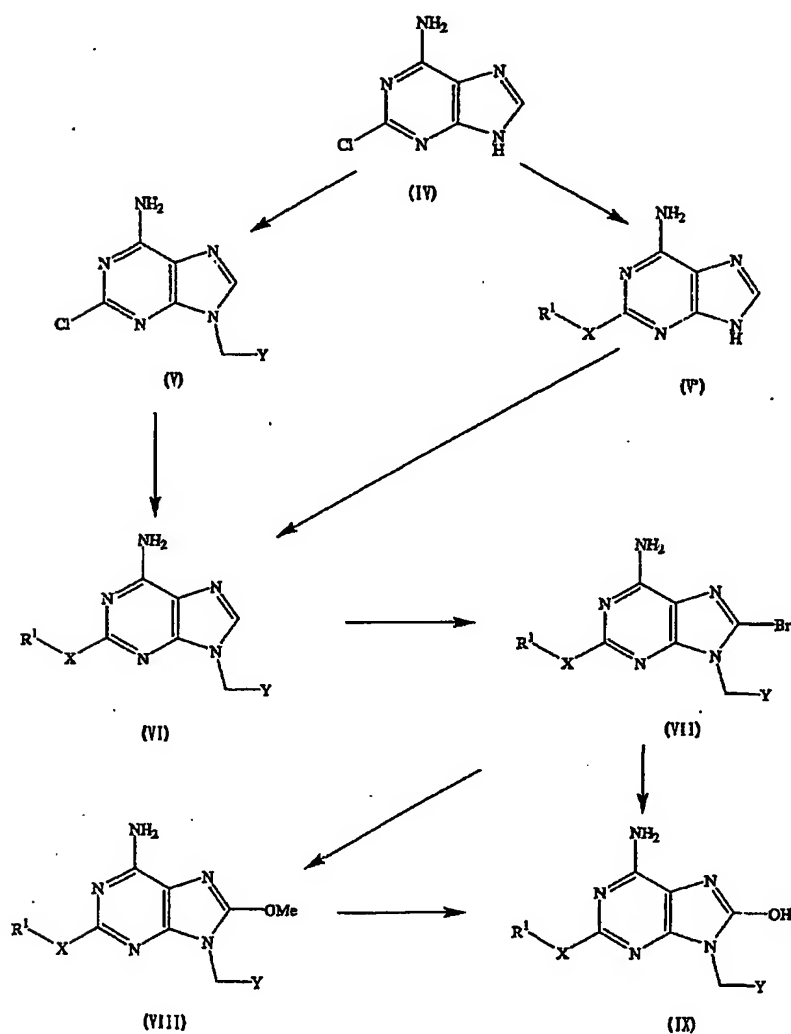
次いで、XがNHの場合は、化合物 (V) と対応する $R^1-NH_2$  (式中、 $R^1$ は前記と同義である) とを塩基の存在下または非存在下に反応させて2-置換体 (VI) を合成する。塩基としてはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジンなどの3級アミン類、溶媒としてはテトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、ジグライムなどの非プロトン性溶媒やプロパノール、ブタノールなどのアルコール系溶媒を用いることができ、あるいは無溶媒で行ってもよい。反応温度は50℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。

Xが酸素原子または硫黄原子の場合は、化合物 (V) と対応する $R^1-OH$ または $R^1-SH$ とを塩基の存在下に反応させて2-置換体 (VI) を合成する。塩基としてはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物等を用いることができ、溶媒としてはジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、ジグライムなどの非プロトン性溶媒を用いるか、あるいは無溶媒で行うこともできる。反応温度は50℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。

なお、化合物 (IV) から化合物 (VI) を製造する工程において、最初に2-置換体 (V') を合成し、次いで、該2-置換体 (V') と $Y-CH_2-Hal$  (式中、Yは式 (II) と同義で、Halはハロゲン原子を表す。) とを反応させて化合物 (VI) を得ることもできる。

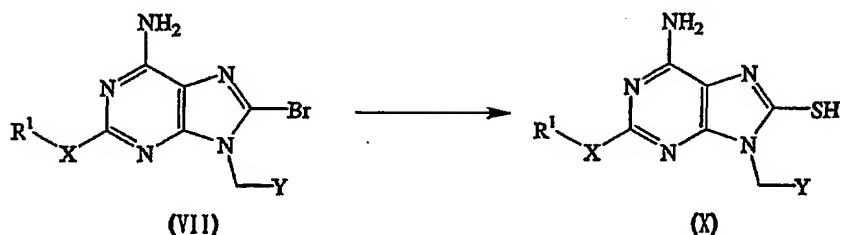
化合物 (VII) は、化合物 (VI) と臭素とを反応させて合成することができる。溶媒としては四塩化炭素、ジクロロメタン、クロロホルムなどのハロゲン系溶媒、酢酸などを用いることができる。反応温度は0℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。また、反応においては酢酸ナトリウムなどの反応助剤を加えてもよい。

化合物 (IX) は、化合物 (VII) を酸性条件下で加水分解することにより合成することができる。酸としては塩酸、臭化水素酸などを用いることができる。反応温度は50℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。あるいは、化合物 (VII) とナトリウムメトキシドとを反応させて化合物 (VIII) とした後に、酸処理して脱メチル化することにより (IX) を得ることもできる。

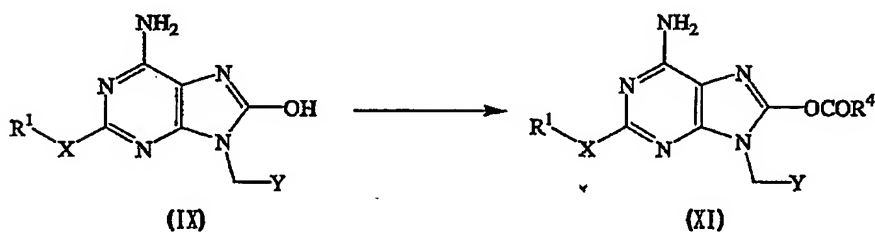


化合物 (X) は、化合物 (VII) に水硫化ナトリウム（硫化水素ナトリウム）を反応させて合成することができる。溶媒はエタノール、プロパノール、ブタノールな

どのアルコール系溶媒を用いることができる。反応温度は50℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる。



化合物 (XI) は、化合物 (IX) を塩基存在下、 $R^2$  に対応するアシルクロリドあるいはクロロギ酸エステルと反応させることにより得ることができる。塩基としてはトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジンなどの3級アミン類、溶媒としてはテトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ジクロロメタンなどの非プロトン性溶媒を用いることができる。反応温度は0℃から溶媒の還流温度までの間で行うことができる（式中、 $R^4$  は炭素数1～7のアルキル基または炭素数1～7のアルコキシ基を表す。）。



以上のようにして得られる本発明のアデニン誘導体は、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、硝酸塩、酢酸塩、メタンスルホン酸塩、トルエンスルホン酸塩、クエン酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩などの薬学的に許容される塩としても用いることもできる。

本発明のアデニン誘導体は、B型及びC型肝炎、エイズなどのウイルス疾患、癌疾患及びタイプ2-ヘルパーT細胞を起因とする疾患等の治療薬として有用であ

り、錠剤、カプセル剤、散剤などの経口剤をはじめ、注射剤、外用剤など種々の剤形で使用することができる。本発明の医薬としては、一般式 (I) で表される化合物、その互変異性体、及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選ばれる物質を用いることができ、さらにそれらの水和物、または溶媒和物を用いてもよい。これらの物質の2以上を適宜組み合わせて用いてもよい。これらの群から選ばれる物質自体を本発明の医薬として投与してもよいが、通常は、有効成分である上記物質と薬学的に許容される製剤用添加物とを含む医薬組成物の形態で投与することが望ましい。

生体内に適用するための医薬組成物は、有効成分である上記物質を薬学的に許容される製剤用添加物の1種または2種以上と混合し、薬学の分野において汎用の製剤方法に従って容易に製造することができる。本発明の医薬の投与経路は特に限定されないが、治療および／または予防に際して最も効果的な経路を適宜選択することが望ましい。経口投与に適する医薬組成物としては、例えば、カプセル剤、散剤、錠剤、顆粒剤、細粒剤、シロップ剤、液剤、懸濁剤などを挙げることができ、非経口的に適する医薬組成物としては、例えば、吸入剤、噴霧剤、直腸内投与剤、注射剤、点滴剤、軟膏、クリーム剤、経皮吸収剤、経粘膜吸収剤、点眼剤、点鼻剤、点耳剤、テープ剤、貼付剤などを挙げることができるが、本発明の医薬の形態はこれらに限定されることはない。

経口投与に適当な医薬組成物のうち、例えば乳剤およびシロップ剤などの液体製剤は、水；ショ糖、ソルビット、果糖等の糖類；ポリエチレングリコール、プロピレングリコール等のグリコール類；ごま油、オリーブ油、大豆油等の油類；p-ヒドロキシ安息香酸エステル類等の防腐剤；ストロベリーフレーバー、ペパーミント等のフレーバー類などの製剤用添加物を用いて製造することができる。カプセル剤、錠剤、散剤、および顆粒剤などの固形製剤は、乳糖、ブドウ糖、ショ糖、マンニト等の賦形剤；デンプン、アルギン酸ソーダ等の崩壊剤；ステアリン酸マグネシウム、タルク等の滑沢剤；ポリビニルアルコール、ヒドロキシプロピルセルロース、ゼラチン等の結合剤；脂肪酸エステル等の界面活性剤；グリセリン等の可塑剤等を用いて製造することができる。

非経口投与に適する医薬組成物のうち、注射剤、点滴剤、点眼剤などの形態の

液体製剤は、好ましくは滅菌された等張の液体製剤として調製することができる。例えば、注射剤は、塩溶液、ブドウ糖溶液、または塩水とブドウ糖溶液との混合物からなる水性媒体を用いて調製することができる。直腸内投与剤は、例えばカカオ脂、水素化脂肪、または水素化カルボン酸等の担体を用いて、通常は坐剤の形態として調製することができる。また、噴霧剤の調製には、有効成分である上記の物質を微細な粒子として分散させて吸収を容易にする非刺激性の担体を用いることができる。このような担体として、例えば、乳糖、グリセリン等を挙げることができる。製剤の形態としてはエアロゾルやドライパウダー等の形態を選択することが可能である。なお、非経口投与用の医薬組成物の製造においても、経口剤で例示した希釈剤、香料、防腐剤、賦形剤、崩壊剤、滑沢剤、結合剤、界面活性剤、可塑剤等から選択される1種または2種以上の製剤用添加物を適宜用いることができる。もっとも、本発明の医薬の製造に用いられる製剤用添加物は上記のものに限定されることはなく、当業者に利用可能なものであればいかなるものを用いてもよい。

本発明のアデニン誘導体の用量は、患者の性別、年齢、体重、疾患の種類、症状などに応じて適宜定めるものであるが、一般に、1日当たり0.001～100 mg/kgの範囲で、好ましくは0.01～10 mg/kgの範囲で、単回又は数回に分けて投与することができる。

本明細書は本願の優先権の基礎である特願2001-118232号の明細書に記載される内容を包含する。

#### 図面の簡単な説明

図1は、ラット好酸球浸潤モデルにおける本発明の化合物の薬効評価試験の結果を示す図である。

図2は、マウス能動皮膚アナフィラキシーモデルにおける本発明の化合物の薬効評価試験の結果を示す図である。

図3は、実施例65に記載の抗腫瘍効果試験の結果を示す図である。実施例27の化合物、及びマウスインターフェロン $\alpha$ のそれぞれについて腫瘍容積をピークル（対照群）と比較した。

図4は、実施例66に記載の抗腫瘍効果（転移抑制効果）試験の結果を示す図である。ピークル（対照群）、マウスインターフェロン $\alpha$ 及び実施例27の化合物の各投与群について各リンパ節の湿重量を比較した。

#### 発明を実施するための最良の形態

以下に、実施例をあげて本発明を具体的に説明するが、本発明の範囲はこれらに限定されるものではない。

#### 参考例1: 2-ブトキシアデニン

ブタノール(480 mL)にナトリウム(13.6 g, 0.59 mol)を加え、90℃まで昇温して完溶させた。続いて2-クロロアデニン(4.0 g, 23.6 mmol)を加え、9時間加熱還流した。4℃まで冷却した後、反応液に水(400 mL)を加え30分間、強く攪拌した。分層したブタノール層を減圧濃縮した後、残渣に水(400 mL)を加え、氷冷下濃塩酸を滴下して中和した。析出した固体を濾取し、得られた固体をエタノール(70 mL)に加え、30分間加熱還流した。室温まで冷却した後、析出した固体を濾取しすることで標記化合物を3.72 g得た(収率: 76%)。

#### 参考例2: 8-ブロモ-2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニン

参考例1で得られた2-ブトキシアデニン(2.60 g, 12.5 mmol)のDMF溶液(125 mL)に、炭酸カリウム(2.85 g, 20.6 mmol)と2-クロロ-5-クロロメチルピリジン(3.33 g, 20.6 mmol)を加え、80℃で2.5時間加熱攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、水(100 mL)を加え1N塩酸で中和し、析出した固体を濾取した。この固体を塩化メチレン(100 mL)に溶解させた後、氷冷下ヘキサン(150 mL)を加え、析出した結晶を濾取することにより2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニンを得た(収量: 3.12 g)。酢酸ナトリウム(3.05 g, 37.2 mmol)と2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニン(3.1 g, 9.31 mmol)を加えた酢酸懸濁液(186 mL)に、室温で臭素(1.92 mL, 37.5 mmol)を加え、4時間反応させた。反応液を減圧留去した後、残渣に水(200 mL)を加え、氷冷下5N水酸化ナトリウムで中和した。析出した結晶を濾取した後、粗結晶をメタノールにて再結晶した。40℃で15時間減圧乾燥して、白色粉末結晶として標記化合物を2.38 g得た(収率: 62%)。

#### 参考例3: 2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-メトキシアデニン

メタノール(110 mL)にナトリウム(614 mg, 26.7 mmol)を加え完溶させた。この溶液に参考例2で得られた8-ブロモ-2-プトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニン(2.2 g, 5.34 mmol)を加え、3.5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水(100 mL)を加え氷冷下、濃塩酸で中和した。析出した固体を濾取、水洗した(20 mL)。この固体を酢酸エチル(30 mL)で再結晶させることにより白色粉末結晶として標記化合物を1.26 g得た(収率: 65.0%)。

参考例4: 2-プトキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル)アデニン

メタノール(18 mL)にナトリウム415 mg, 18.0 mmol)を加え完溶させた後、2-プトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)アデニン(300 mg, 0.90 mmol)を加え24時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水(30 mL)を加え、氷冷下、濃塩酸で中和した。析出した固体を濾取した後、粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し(塩化メチレン:メタノール 50:1)、標記化合物を148 mg得た(収率: 50%)。

参考例5: 2-ブチルアミノアデニン

オートクレーブ(200 mL)に2-クロロアデニン(6.0 g, 35.4 mmol)とブチルアミン(30 mL)を加え、130℃で150時間反応させた。反応液を減圧濃縮した後、残渣に水を注入し固体を析出させた。析出固体を塩化メチレン、メタノールで順次洗浄して、黄橙色粉末固体として標記化合物を2.08 g得た(収率: 30%)。

実施例1: 2-プトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

濃塩酸(70 mL)に参考例3で得られた化合物(1.26 g, 3.47 mmol)を加え、室温で2時間反応させた。反応液を減圧濃縮した後、残渣に水(130 mL)を加え氷冷下、5N 水酸化ナトリウム水溶液で中和した。析出した結晶を濾取・乾燥することにより白色粉末結晶として標記化合物を1.20 g得た(収率: 99%)。

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ 10.14 (1H, brs), 8.40 (1H, d, J = 2.4 Hz), 7.76 (1H, d, J = 2.4, 8.4 Hz), 7.49 (1H, d, J = 8.4 Hz), 6.55 (2H, brs), 4.91 (2H, s), 4.14 (2H, t, J = 6.5 Hz), 1.67-1.57 (2H, m), 1.44-1.30 (2H, m), 0.90 (3H, t, J = 7.3 Hz).

実施例2: 2-プトキシ-8-ヒドロキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル)アデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。



$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.09 (1H, brs), 8.16 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.65 (1H, d,  $J = 2.4, 8.4$  Hz), 6.78 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 6.49 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 4.15 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 3.81 (3H, s), 1.66-1.58 (2H, m), 1.42-1.34 (2H, m), 0.91 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例3: 2-ブトキシ-9-(6-エトキシ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.06 (1H, brs), 8.14 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.64 (1H, d,  $J = 2.4, 8.6$  Hz), 6.75 (1H, d,  $J = 8.6$  Hz), 6.48 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 4.26 (2H, q,  $J = 7.2$  Hz), 4.15 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.68-1.58 (2H, m), 1.42-1.34 (2H, m), 1.28 (3H, t,  $J = 7.2$  Hz), 0.91 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例4: 2-ブトキシ-9-(6-n-ブトキシ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.25 (1H, brs), 8.13 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 7.63 (1H, d,  $J = 1.9, 8.4$  Hz), 6.75 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 6.53 (2H, brs), 4.79 (2H, s), 4.23-4.12 (4H, m), 1.68-1.60 (4H, m), 1.42-1.34 (4H, m), 0.94-0.88 (6H, m).

実施例5: 2-ブトキシ-9-(2-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.15 (1H, brs), 8.36-8.33 (1H, m), 7.52-7.50 (1H, m), 7.41-7.36 (1H, m), 6.53 (2H, brs), 4.94 (2H, s), 4.07 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.62-1.52 (2H, m), 1.37-1.23 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例6: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(2-メトキシ-3-ピリジルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.06 (1H, brs), 8.08-8.06 (1H, m), 7.21-7.19 (1H, m), 6.93-6.88 (1H, m), 6.47 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 4.08 (2H, t,  $J = 6.5$  Hz), 3.92 (3H, s), 1.60-1.53 (2H, m), 1.38-1.29 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例7: 2-ブトキシ-9-(6-クロロ-5-メトキシ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.06 (1H, brs), 8.12 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 7.85 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 6.49 (2H, brs), 4.83 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 3.91 (3H, s), 1.66-1.61 (2H, m), 1.42-1.34 (2H, m), 0.91 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例8: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン

2-クロロアデニン (520mg, 3mmol) のDMF溶液 (30ml) に、炭酸カリウム (1.1 g, 8mmol) と3-クロロメチルピリジン・塩酸塩 (660mg, 5mmol) を加え、80℃で3時間加熱撹拌した。反応液を減圧濃縮した後、水を加え析出した固体を濾取することにより2-クロロ-9-(3-ピリジルメチル)アデニンを得た (収量: 759mg)。ブタノール (50ml) にナトリウム (750mg, 30mmol) を加え、90℃まで昇温して完溶させた。続いて2-クロロ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン (430mg, 1.5mmol) を加え、2時間加熱環流した。溶媒を減圧濃縮した後、残渣に水を加え、氷冷下に濃塩酸を滴下して中和した。塩化メチレンを加えて分液し、有機層を減圧濃縮した。残渣へ酢酸30mlを加えて溶解させた後、臭素 (660mg, 5.5mmol) を加え、室温で一昼夜反応させた。反応液を減圧留去した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し (塩化メチレン: メタノール 10:1)、8-プロモ-2-ブトキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニンを310mg得た。引き続き、参考例3及び実施例1と同様の操作により標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.22 (1H, brs), 8.56 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 8.49-8.47 (1H, m), 7.71-7.67 (1H, m), 7.38-7.33 (1H, m), 6.54 (2H, brs), 4.90 (2H, s), 4.14 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.65-1.57 (2H, m), 1.41-1.33 (2H, m), 0.90 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例9: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(4-ピリジルメチル)アデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.20 (1H, brs), 8.70-8.68 (2H, m), 7.29-7.27 (2H, m), 6.48 (2H, brs), 4.92 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.63-1.55 (2H,

m), 1.40-1.32 (2H, m), 0.89 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例10: 2-ブトキシ-9-(ピラジン-2-イルメチル)-8-メトキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.02 (1H, brs), 8.66 (1H, s), 8.56-8.53 (2H, m), 6.48 (2H, brs), 5.05 (2H, s), 4.06 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.59-1.51 (2H, m), 1.37-1.29 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例11: 2-ブトキシ-9-(5,6-ジクロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例2と同様にして得られた 2-*n*-ブトキシ-8-ブロモ-9-(5,6-ジクロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン (150 mg, 0.34 mmol) のブタノール (4 mL) 懸濁液に濃塩酸 (4 mL) を加え、70℃で9時間反応させた。反応液を減圧濃縮した後、氷冷下、残渣に水 (30 mL) を加え、1N水酸化ナトリウム水溶液で中和した。析出した固体を濾取した後、粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し (塩化メチレン:メタノール 25:1)、白色粉末結晶として標記化合物を45 mg 得た (収率: 35%)。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.16 (1H, brs), 8.36 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 8.06 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 6.52 (2H, brs), 4.93 (2H, s), 4.13 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.64-1.58 (2H, m), 1.40-1.32 (2H, m), 0.90 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例12: 2-ブトキシ-9-(2,6-ジクロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

対応する出発物質を用いて実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.12 (1H, brs), 7.66 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 7.52 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 6.52 (2H, brs), 4.92 (2H, s), 4.08 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.60-1.52 (2H, m), 1.37-1.29 (2H, m), 0.88 (3H, t,  $J = 7.4$  Hz).

実施例13: 2-ブトキシ-9-(6-ピペリジノ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

ピペリジン (3 mL) に実施例1で得られる化合物 (100 mg, 0.29 mmol) を加え、90℃で30時間反応させた。反応液を減圧濃縮した後、残渣に塩化メチレン (50 mL) を加え固体を析出させた。析出固体を濾取し、水洗することにより白色粉末固体

として標記化合物を56 mg得た (収率: 49%)。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.79 (1H, brs), 8.09 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.47 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.6$  Hz), 6.75 (1H, d,  $J = 8.6$  Hz), 6.44 (2H, brs), 4.70 (2H, s), 4.17 (2H, t,  $J = 6.5$  Hz), 3.48-3.44 (4H, m), 1.67-1.35 (10H, m), 0.92 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例14: 2-ブトキシ-9-(6-(1-ピロリジニル)-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

実施例1で得られる化合物とピロリジンを用いて、実施例13と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.03 (1H, brs), 8.07 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.46 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.6$  Hz), 6.45 (2H, brs), 6.37 (1H, d,  $J = 8.6$  Hz), 4.69 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 3.33-3.29 (4H, m), 1.93-1.88 (4H, m), 1.67-1.59 (2H, m), 1.43-1.35 (2H, m), 0.92 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例15: 2-ブトキシ-9-(6-モルホリノ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

実施例1で得られる化合物とモルホリンを用いて、実施例13と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.01 (1H, brs), 8.14 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.53 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.6$  Hz), 6.78 (1H, d,  $J = 8.6$  Hz), 6.45 (2H, brs), 4.73 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 3.66 (4H, t,  $J = 4.9$  Hz), 3.38 (4H, t,  $J = 4.9$  Hz), 1.67-1.61 (2H, m), 1.43-1.35 (2H, m), 0.92 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例16: 2-ブトキシ-9-(6-ジメチルアミノ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

実施例1で得られる化合物と40%ジメチルアミン水溶液を用いて、実施例13と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.12 (1H, brs), 8.09 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.48 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.9$  Hz), 6.57 (1H, d,  $J = 8.9$  Hz), 6.49 (2H, brs), 4.70 (2H, s), 4.16 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 2.97 (6H, s), 1.70-1.46 (2H, m), 1.43-1.3

3 (2H, m), 0.92 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例17: 2-ブチルアミノ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.10 (1H, brs), 8.56 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 8.49-8.47 (1H, m), 7.71-7.67 (1H, m), 7.38-7.33 (1H, m), 6.50 (2H, brs), 4.90 (2H, s), 4.14 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.67-1.57 (2H, m), 1.41-1.30 (2H, m), 0.90 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例18: 2-ブチルアミノ-9-(2-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.76 (1H, brs), 8.35-8.32 (1H, m), 7.47-7.36 (2H, m), 6.23 (1H, brt,  $J = 5.7$  Hz), 6.07 (2H, s), 4.88 (2H, s), 3.13-3.05 (2H, m), 1.43-1.27 (2H, m), 1.24-1.16 (2H, m), 0.82 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例19: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル)アデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.07 (1H, brs), 8.17 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.67 (1H, d,  $J = 2.4, 8.4$  Hz), 6.82-6.76 (2H, m), 6.60 (2H, brs), 4.78 (2H, s), 3.81 (3H, s), 3.25-3.17 (2H, m), 1.54-1.43 (2H, m), 1.38-1.25 (2H, m), 0.89 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例20: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(2-ピリジルメチル)アデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.88 (1H, s), 8.56-8.54 (1H, m), 8.05-7.89 (3H, m), 7.46-7.41 (2H, m), 5.05 (3H, s), 3.19-3.14 (2H, m), 1.44-1.21 (4H, m), 0.

81 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例21: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(3-ピリジルメチル) アデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.78 (1H, brs), 8.55 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 8.47 (1H, dd,  $J = 1.9, 4.9$  Hz), 7.68 (1H, d,  $J = 7.8$  Hz), 7.34 (1H, dd,  $J = 4.9, 7.8$  Hz), 6.21 (1H, brt,  $J = 5.5$  Hz), 6.05 (2H, brs), 4.84 (2H, s), 3.20-3.12 (2H, m), 1.47-1.39 (2H, m), 1.32-1.24 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例22: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(4-ピリジルメチル) アデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.05 (1H, brs), 8.76 (2H, d,  $J = 8.7$  Hz), 8.09-7.88 (3H, m), 7.73 (2H, d,  $J = 8.7$  Hz), 5.09 (2H, s), 3.22-3.17 (2H, m), 1.47-1.32 (2H, m), 1.29-1.18 (2H, m), 0.82 (3H, t,  $J = 7.4$  Hz).

実施例23: 2-ブチルアミノ-9-(2,6-ジクロロ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.82 (1H, brs), 7.61-7.51 (2H, m), 6.23 (1H, brt,  $J = 5.4$  Hz), 6.08 (2H, s), 4.87 (2H, s), 3.12-3.05 (2H, m), 1.40-1.19 (4H, m), 0.82 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例24: 2-ブチルアミノ-9-(6-ジメチルアミノ-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

実施例17で得られる化合物と40%ジメチルアミン水溶液を用いて、実施例13と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.61 (1H, brs), 8.10 (1H, d,  $J = 2.2$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J = 2.2, 8.6$  Hz), 6.56 (1H, d,  $J = 8.6$  Hz), 6.18 (1H, brt,  $J = 5.7$  Hz), 5.97 (2H, brs), 4.65 (2H, s), 3.22-3.15 (2H, m), 2.97 (6H, s), 1.53-1.

42 (2H, m), 1.38-1.24 (2H, m), 0.89 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例25: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.95 (1H, s), 8.42 (1H, d,  $J = 2.2$  Hz), 7.58 (1H, dd,  $J = 2.2, 8.1$  Hz), 7.20 (1H, d,  $J = 8.1$  Hz), 6.46 (2H, brs), 4.84 (2H, s), 4.14 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 2.41 (3H, s), 1.62 (2H, m), 1.37 (2H, m), 0.90 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例26: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9-(2-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様にして標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.01 (1H, brs), 8.33 (1H, d,  $J = 3.1$  Hz), 7.39 (1H, d,  $J = 6.4$  Hz), 7.15 (1H, dd,  $J = 3.1, 6.4$  Hz), 6.49 (2H, brs), 4.88 (2H, s), 4.10 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 2.59 (3H, s), 1.59 (2H, m), 1.34 (2H, m), 0.88 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例27: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.78 (1H, s), 8.42 (1H, d,  $J = 2.2$  Hz), 7.57 (1H, dd,  $J = 2.2, 8.0$  Hz), 7.19 (1H, d,  $J = 8.0$  Hz), 6.22 (1H, t,  $J = 7.1$  Hz), 6.09 (2H, brs), 4.78 (2H, s), 3.16 (2H, m), 2.41 (3H, s), 1.44 (2H, m), 1.28 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 9.6$  Hz).

実施例28: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(2-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.70 (1H, s), 8.32 (1H, d,  $J = 3.1$  Hz), 7.37 (1H, d,  $J = 7.7$  Hz), 7.14 (1H, dd,  $J = 3.1, 7.7$  Hz), 6.20 (1H, t,  $J = 6.4$  Hz), 6.0 (2H, brs), 4.82 (2H, s), 3.12 (2H, m), 2.60 (3H, s), 1.39 (2H, m), 1.25 (2H, m), 0.84 (3H, t,  $J = 7.1$  Hz).

実施例29: 2-ブチルアミノ-9-(2-クロロ-6-メチル-3-ピリジルメチル)-8-ヒドロキシアデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.74 (1H, brs), 7.33 (1H, d,  $J = 5.8$  Hz), 7.22 (1H, d,  $J = 5.8$  Hz), 6.24 (1H, m), 6.06 (2H, brs), 4.83 (2H, s), 3.09 (2H, m), 2.42 (3H, s), 1.37 (2H, m), 1.25 (2H, m), 0.82 (3H, t,  $J = 5.5$  Hz).

実施例30: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(6-ヒドロキシ-3-ピリジルメチル)アデニン

参考例5で得られる化合物を用いて、実施例11と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.50 (1H, brs), 9.61 (1H, brs), 7.45 (1H, dd,  $J = 2.6$ , 9.5 Hz), 7.28 (1H, d,  $J = 2.6$  Hz), 6.28 (1H, d,  $J = 9.5$  Hz), 6.22 (1H, t,  $J = 6.2$  Hz), 6.00 (2H, brs), 4.53 (2H, s), 3.17 (2H, q,  $J = 6.2$  Hz), 1.45 (2H, m), 1.30 (2H, m), 0.88 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例31: 8-ヒドロキシ-2-(2-メトキシ)エトキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン

対応する出発物質を用いて実施例1と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.02 (1H, brs), 8.57 (1H, s), 8.48 (1H, d,  $J = 4.8$  Hz), 7.70 (1H, d,  $J = 6.1$  Hz), 7.36 (1H, dd,  $J = 4.8$ , 6.1 Hz), 6.50 (2H, brs), 4.90 (2H, s), 4.27 (2H, t,  $J = 4.6$  Hz), 3.59 (2H, t,  $J = 4.6$  Hz), 3.27 (3H, s).

実施例32: 8-ヒドロキシ-2-メトキシ-9-(3-ピリジルメチル)アデニン

実施例1と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.04 (1H, brs), 8.57 (1H, s), 8.48 (1H, d,  $J = 4.8$  Hz), 7.71 (1H, d,  $J = 6.1$  Hz), 7.35 (1H, dd,  $J = 4.8$ , 6.1 Hz), 6.53 (2H, brs), 4.90 (2H, s), 3.76 (3H, s).

実施例33: 2-ブチルアミノ-8-エトキシカルボニルオキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル)アデニン



実施例19で得られる化合物 (200 mg, 0.58 mmol) の塩化メチレン溶液 (15 mL) に、トリエチルアミン (100  $\mu$ L, 0.75 mmol)、クロロギ酸エチル (67  $\mu$ L, 0.70 mmol)、ジメチルアミノピリジン (20 mg, 0.17 mmol) を順次加え、室温で15時間反応させた。反応液に水を加え有機層を抽出した。5% クエン酸水溶液、10%食塩水で洗浄して無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を減圧留去した。残渣にヘキサンを加え、固体を析出させて濾取し、白色粉末固体として標記化合物を170 mg 得た (収率: 71%)。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.33 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 7.75 (1H, dd,  $J = 1.9, 8.4$  Hz), 6.15 (2H, brs), 6.67 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 4.87 (2H, s), 4.71 (1H, brt,  $J = 5.4$  Hz), 4.46 (2H, q,  $J = 7.1$  Hz), 3.90 (3H, s), 3.41-3.34 (2H, m), 1.60-1.35 (7H, m), 0.96 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz)。

実施例34: 2-ブチルアミノ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-エトキシカルボニルオキシアデニン

実施例17で得られる化合物とクロロギ酸エチルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.81 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.4$  Hz), 7.27 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 6.06 (2H, brs), 4.93 (2H, s), 4.83 (1H, brt,  $J = 5.5$  Hz), 4.47 (2H, q,  $J = 7.1$  Hz), 3.40-3.32 (2H, m), 1.59-1.36 (7H, m), 0.95 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz)。

実施例35: 2-ブチルアミノ-8-イソプロポキシカルボニルオキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例19で得られる化合物とクロロギ酸イソプロピルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.32 (1H, d,  $J = 2.2$  Hz), 7.74 (1H, dd,  $J = 2.2, 8.9$  Hz), 6.68 (1H, d,  $J = 8.9$  Hz), 6.08 (2H, brs), 5.23-5.13 (1H, m), 4.89 (1H, brt,  $J = 5.8$  Hz), 4.87 (2H, s), 3.91 (3H, s), 3.42-3.35 (2H, m), 1.60-1.52 (2H, m), 1.48-1.37 (8H, m), 0.96 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz)。

実施例36: 2-ブチルアミノ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-イソプロポキシカルボニルオキシアデニン

実施例17で得られる化合物とクロロギ酸イソプロピルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 7.80 (1H, dd,  $J = 1.9, 8.4$  Hz), 7.27 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 6.14 (2H, brs), 5.24-5.14 (1H, m), 4.96-4.92 (3H, m), 3.40-3.33 (2H, m), 1.62-1.51 (2H, m), 1.45-1.34 (8H, m), 0.95 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例37: 2-ブトキシ-8-エトキシカルボニルオキシ-9-(6-メトキシ-3-ピリジルメチル)アデニン

実施例2で得られる化合物とクロロギ酸エチルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.33 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.75 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.1$  Hz), 6.68 (1H, d,  $J = 8.1$  Hz), 6.15 (2H, brs), 4.93 (2H, s), 4.48 (2H, q,  $J = 7.1$  Hz), 4.30 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 3.90 (3H, s), 1.83-1.72 (2H, m), 1.53-1.43 (5H, m), 0.98 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例38: 2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-エトキシカルボニルオキシアデニン

実施例1で得られる化合物とクロロギ酸エチルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.81 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.4$  Hz), 7.29 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 7.28 (2H, brs), 4.99 (2H, s), 4.49 (2H, q,  $J = 7.0$  Hz), 4.28 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.81-1.71 (2H, m), 1.52-1.43 (5H, m), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例39: 2-ブトキシ-9-(2-クロロ-3-ピリジルメチル)-8-エトキシカルボニルオキシアデニン

実施例5で得られる化合物とクロロギ酸エチルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.37-8.35 (1H, m), 7.73-7.69 (1H, m), 7.41-7.37 (1H, m), 7.09 (2H, brs), 4.95 (2H, s), 4.39 (2H, q,  $J = 7.2$  Hz), 4.12 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.61-1.53 (2H, m), 1.37-1.29 (5H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

Hz).

実施例40: 2-ブトキシ-8-メトキシカルボニルオキシ-9-(3-ピリジルメチル) アデニン

実施例8で得られる化合物とクロロギ酸メチルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.77 (1H, d,  $J = 2.2\text{ Hz}$ ), 8.56-8.53 (1H, m), 7.85-7.81 (1H, m), 7.25 (2H, brs), 7.24-7.22 (1H, m), 5.02 (2H, s), 4.30 (2H, t,  $J = 6.6\text{ Hz}$ ), 4.05 (3H, s), 1.82-1.72 (2H, m), 1.53-1.42 (2H, m), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3\text{ Hz}$ ).

実施例41: 2-ブトキシ-8-(n-ペンチルオキシ)カルボニルオキシ-9-(3-ピリジルメチル) アデニン

実施例8で得られる化合物とクロロギ酸n-ペンチルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.59 (1H, d,  $J = 1.9\text{ Hz}$ ), 8.51-8.48 (1H, m), 7.75-7.72 (1H, m), 7.39-7.34 (1H, m), 7.07 (2H, brs), 4.92 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J = 6.6\text{ Hz}$ ), 4.18 (2H, t,  $J = 6.5\text{ Hz}$ ), 1.71-1.61 (4H, m), 1.41-1.31 (6H, m), 0.93-0.85 (6H, m).

実施例42: 2-ブトキシ-8-(シクロヘキシルオキシ)カルボニルオキシ-9-(3-ピリジルメチル) アデニン

実施例8で得られる化合物とクロロギ酸シクロヘキシルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.60 (1H, d,  $J = 1.9\text{ Hz}$ ), 8.51-8.49 (1H, m), 7.76-7.72 (1H, m), 7.39-7.35 (1H, m), 7.07 (2H, brs), 4.96-4.93 (3H, m), 4.18 (2H, t,  $J = 6.5\text{ Hz}$ ), 1.86-1.58 (8H, m), 1.44-1.33 (6H, m), 0.91 (3H, t,  $J = 7.4\text{ Hz}$ ).

実施例43: 8-(アリルオキシ)カルボニルオキシ-2-ブトキシ-9-(3-ピリジルメチル) アデニン

実施例8で得られる化合物とクロロギ酸アリルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.61 (1H, d,  $J = 1.9$  Hz), 8.51-8.49 (1H, m), 7.77-7.74 (1H, m), 7.39-7.35 (1H, m), 7.25 (1H, dd,  $J = 6.5, 13.8$  Hz), 7.03 (2H, brs), 5.06 (1H, dd,  $J = 1.9, 13.8$  Hz), 4.93 (2H, s), 4.86 (1H, dd,  $J = 1.9, 6.5$  Hz), 4.19 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 1.64-1.41 (2H, m), 1.39-1.33 (2H, m), 0.91 (3H, t,  $J = 7.4$  Hz).

実施例44: 8-アセチルオキシ-2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例17で得られる化合物と無水酢酸を用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.80 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.4$  Hz), 7.30 (1H, d,  $J = 8.4$  Hz), 7.28 (2H, brs), 5.00 (2H, s), 4.29 (2H, t,  $J = 6.5$  Hz), 2.72 (3H, s), 1.82-1.71 (2H, m), 1.52-1.42 (2H, m), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例45: 8-プロピオニルオキシ-2-ブトキシ-9-(6-クロロ-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例17で得られる化合物と塩化プロピオニルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.80 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.1$  Hz), 7.30 (1H, d,  $J = 8.1$  Hz), 7.28 (2H, brs), 5.00 (2H, s), 4.29 (2H, t,  $J = 6.5$  Hz), 3.14 (2H, q,  $J = 7.4$  Hz), 1.82-1.71 (2H, m), 1.55-1.42 (2H, m), 1.23 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz).

実施例46: 8-ベンゾイルオキシ-2-ブトキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン

実施例25で得られる化合物と塩化ベンゾイルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J = 2.4$  Hz), 7.77 (2H, d,  $J = 7.3$  Hz), 7.69 (1H, dd,  $J = 2.4, 8.1$  Hz), 7.63 (1H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.49 (2H, t,  $J = 7.3$  Hz), 7.09 (1H, d,  $J = 8.1$  Hz), 5.76 (2H, brs), 4.95 (2H, s), 4.34 (2H, t,  $J = 6.6$  Hz), 2.52 (3H, s), 1.78 (2H, m), 1.52 (2H, m), 0.99 (3H, t,

$J = 7.3 \text{ Hz}$ ).

実施例47: 8-ベンゾイルオキシ-2-ブチルアミノ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル)アデニン

実施例27で得られる化合物と塩化ベンゾイルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J = 2.0 \text{ Hz}$ ), 7.74 (2H, d,  $J = 7.4 \text{ Hz}$ ), 7.69 (1H, dd,  $J = 2.0, 7.9 \text{ Hz}$ ), 7.61 (1H, t,  $J = 7.4 \text{ Hz}$ ), 7.47 (2H, t,  $J = 7.4 \text{ Hz}$ ), 7.08 (1H, d,  $J = 7.9 \text{ Hz}$ ), 5.57 (2H, brs), 4.88 (2H, s), 4.84 (1H, t,  $J = 5.9 \text{ Hz}$ ), 3.40 (2H, m), 2.52 (3H, s), 1.58 (2H, m), 1.42 (2H, m), 0.97 (3H, t,  $J = 7.3 \text{ Hz}$ ).

実施例48: 2-ブトキシ-8-(4-メチル)ベンゾイルオキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル)アデニン

実施例25で得られる化合物と塩化p-トルオイルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.44 (1H, s), 7.73 (2H, d,  $J = 8.2 \text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J = 8.0 \text{ Hz}$ ), 7.30 (2H, d,  $J = 8.2 \text{ Hz}$ ), 7.20 (1H, d,  $J = 8.0 \text{ Hz}$ ), 6.84 (2H, brs), 4.84 (2H, s), 4.22 (2H, t,  $J = 6.6 \text{ Hz}$ ), 2.42 (3H, s), 2.40 (3H, s), 1.66 (2H, m), 1.41 (2H, m), 0.92 (3H, t,  $J = 7.4 \text{ Hz}$ ).

実施例49: 2-ブチルアミノ-8-(4-メチル)ベンゾイルオキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル)アデニン

実施例27で得られる化合物と塩化p-トルオイルを用いて、実施例33と同様の方法で標記化合物を得た。

$^1\text{H NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.43 (1H, s), 7.69 (2H, d,  $J = 8.2 \text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J = 8.0 \text{ Hz}$ ), 7.28 (2H, d,  $J = 8.2 \text{ Hz}$ ), 7.19 (1H, d,  $J = 8.0 \text{ Hz}$ ), 6.71 (1H, brs), 6.25 (2H, brs), 4.80 (2H, s), 3.22 (2H, t,  $J = 6.6 \text{ Hz}$ ), 2.42 (3H, s), 2.39 (3H, s), 1.46 (2H, m), 1.30 (2H, m), 0.89 (3H, t,  $J = 7.4 \text{ Hz}$ ).

実施例50: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(1-ナフチルメチル)アデニン

参考例5で得られた化合物を用いて、実施例11と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.79 (1H, s), 8.39-8.41 (1H, m), 7.94-7.97 (1H, m), 7.83-7.86 (1H, m), 7.55-7.59 (2H, m), 7.40-7.46 (1H, m), 7.26 (1H, m), 6.17 (1H, t,  $J = 5.8$  Hz), 6.05 (2H, s), 5.28 (2H, s), 3.09-3.16 (2H, m), 1.36-1.44 (2H, m), 1.21-1.29 (2H, m), 0.83 (3H, t,  $J = 7.4$  Hz)

実施例51: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9- (2-ナフチルメチル) アデニン

参考例5で得られた化合物を用いて、実施例11と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.69 (1H, s), 7.84-7.89 (3H, m), 7.74 (1H, s), 7.47-7.52 (3H, m), 6.21 (1H, t,  $J = 5.8$  Hz), 6.03 (2H, s), 4.97 (2H, s), 3.12-3.20 (2H, m), 1.41-1.46 (2H, m), 1.22-1.31 (2H, m), 0.83 (3H, t,  $J = 7.4$  Hz)

実施例52: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9- (1-ナフチルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて、実施例1と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.21 (1H, s), 8.37-8.41 (1H, m), 7.85-7.98 (2H, m), 7.55-7.60 (2H, m), 7.41-7.47 (1H, m), 7.25-7.28 (1H, m), 6.52 (2H, s), 5.34 (2H, s), 4.10 (2H, d,  $J = 6.6$  Hz), 1.55-1.61 (2H, m), 1.29-1.38 (2H, m), 0.87 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz)

実施例53: 2-ブトキシ-8-ヒドロキシ-9- (2-ナフチルメチル) アデニン

対応する出発物質を用いて、実施例1と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  10.12 (1H, s), 7.87-7.90 (3H, m), 7.76 (1H, s), 7.46-7.51 (3H, m), 6.45 (2H, s), 5.02 (2H, s), 4.14 (2H, d,  $J = 6.6$  Hz), 1.55-1.63 (2H, m), 1.31-1.39 (2H, m), 0.88 (3H, t,  $J = 7.3$  Hz)

実施例54: 2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9- (5-クロロ-2-チエニルメチル) アデニン

参考例5で得られた化合物を用いて、実施例11と同様の方法で表記化合物を得た。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.85 (1H, s), 6.96 (1H, d,  $J = 3.8$  Hz), 6.91 (1H, d,  $J = 3.8$  Hz), 6.23 (1H, t,  $J = 5.4$  Hz), 6.07 (2H, s), 4.87 (2H, s), 3.15-3.23 (2H, m), 1.43-1.53 (2H, m), 1.24-1.37 (2H, m), 0.89 (3H, t,  $J = 7$

. 3 Hz)

実施例55：2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシ-9-(6-メチル-3-ピリジルメチル) アデニン 一硫酸塩

実施例27の化合物 (2.52 g, 7.70 mmol) のメタノール溶液 (520 ml) に0.5N 硫酸 (30.8 ml) を加え、析出した結晶を濾取し、標記化合物を得た。

mp 249-252 °C

Calc : C 45.17, H 5.45, N 23.04, S 7.54

Anal : C 44.96, H 5.56, N 22.90, S 7.53

実施例56：マウス脾臓細胞におけるインターフェロン誘導作用 (in vitro)

C3H/HeJ系マウス（雄性；8-10週齢）から脾臓を摘出し、5%FBSを含むMEM培地を用いて $2 \times 10^6$  cells/mlの脾細胞懸濁液を調製し、24穴マイクロプレートの各ウェルに0.5 mlずつ分注した。そして、同培地で希釈した被験化合物（0.2% DMSOを含む）を各ウェルに0.5 mlずつ添加し、5% CO<sub>2</sub>インキュベーター内で37°C、24時間培養した後、培養液を0.2マイクロメートルのフィルターで無菌ろ過して培養上清を得た。培養上清中のインターフェロン力価はJ. A. Armstrong, Methods in Enzymology 78, 381-7に記載のバイオアッセイにより定量した。すなわち $1 \times 10^4$  cells/50  $\mu$ lのマウス繊維芽細胞 L929を96穴の培養プレートで24時間培養後、50  $\mu$ lの希釈培養上清を添加し、更に24時間培養した。続いて水泡性口内炎ウイルスを 100  $\mu$ l ずつ添加し、ウイルス感染後44時間での細胞変性効果をクリスタルバイオレット染色により確認した。定量は、色素を2%デオキシコール酸ナトリウム水溶液で溶解し、595nmの吸収を測定することで行った。なお、参考化合物例1として、9-ベンジル-2-ブチルアミノ-8-ヒドロキシアデニン（W099-28321の実施例24の化合物）、参考化合物例2として、9-ベンジル-2-ブトキシ-8-ヒドロキシアデニン（W099-28321の実施例19の化合物）、比較例1としてR-837（イミキモド）、比較例2としてR-848（1-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-2-メトキシエチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミン）を用いた。表2に各化合物の最少有効濃度を示す。

表 2

## インターフェロン誘導活性

| 化合物   | 最少有効濃度<br>(nM) | 化合物    | 最少有効濃度<br>(nM) |
|-------|----------------|--------|----------------|
| 実施例1  | 1              | 実施例18  | 10             |
| 実施例2  | 1              | 実施例19  | 3              |
| 実施例3  | 1              | 実施例20  | 30             |
| 実施例4  | 10             | 実施例21  | 3              |
| 実施例5  | 3              | 実施例22  | 10             |
| 実施例6  | 1              | 実施例23  | 10             |
| 実施例7  | 1              | 実施例24  | 3              |
| 実施例8  | 1              | 実施例25  | 1              |
| 実施例9  | 3              | 実施例26  | 1              |
| 実施例10 | 10             | 実施例27  | 3              |
| 実施例11 | 3              | 実施例28  | 10             |
| 実施例12 | 10             | 実施例29  | 10             |
| 実施例13 | 3              | 参考化合物1 | 100            |
| 実施例14 | 1              | 参考化合物2 | 1              |
| 実施例15 | 1              | 比較例1   | 300            |
| 実施例16 | 1              | 比較例2   | 3              |
| 実施例17 | 3              |        |                |

実施例57: マウスにおけるインターフェロン誘導作用 (in vivo)

被験化合物を0.5%カルボキシメチルセルロース水溶液に懸濁し、Balb/c雄性マウスに経口投与した。2時間後心臓より採血し、血清中のインターフェロン力価を実施例56と同様の方法で測定した。表3に結果を示す。



表 3

## インターフェロン誘導活性 (U/ml)

|        | 投与量 (mg/kg) |        |          |          |
|--------|-------------|--------|----------|----------|
|        | 0.01        | 0.03   | 0.1      | 0.3      |
| 実施例1   |             | 123±87 | 322±95   | 623±32   |
| 実施例2   | 25±17       | 388±87 | 1211±263 | 2559±495 |
| 実施例3   |             |        | 353±73   | 1966±532 |
| 実施例5   |             |        | 133±33   | 473±9    |
| 実施例6   |             |        | 569±42   | 1222±248 |
| 実施例7   |             |        | 347±149  | 845±22   |
| 実施例8   | 13±5        | 167±97 | 725±141  | 936±438  |
| 実施例9   |             |        |          | 539±107  |
| 実施例10  |             | 89±22  | 409±267  | 733±256  |
| 実施例11  |             |        | 279±177  | 568±160  |
| 実施例12  |             |        |          | 31±5     |
| 実施例13  |             |        |          | 304±138  |
| 実施例14  |             |        |          | 570±63   |
| 実施例15  |             |        | 52±32    | 603±147  |
| 実施例16  |             |        | 251±46   | 716±155  |
| 実施例17  |             | 31±23  | 183±43   | 999±379  |
| 実施例18  |             |        |          | 94±49    |
| 実施例19  | 14±5        | 199±84 | 383±122  | 601±187  |
| 実施例21  |             | 15±8   | 290±134  | 571±164  |
| 実施例22  |             |        | 21±9     | 332±83   |
| 実施例23  |             |        | 42±7     | 414±118  |
| 実施例24  |             |        |          | 403±146  |
| 実施例25  | 65±52       | 151±29 | 753±140  | 721±299  |
| 実施例26  |             | 121±11 | 433±366  | 780±190  |
| 実施例27  |             | 14±3   | 324±66   | 804±274  |
| 実施例28  |             |        | 186±62   | 1462±260 |
| 実施例29  |             |        |          | 619±268  |
| 参考化合物1 |             |        | 55±25    | 275±165  |
| 参考化合物2 |             | 60±40  | 186±42   | 317±160  |
| 比較例2   |             |        | 1638±246 | 1961±950 |

## 実施例58: カニクイザルにおけるインターフェロン誘導作用 (in vivo)

被験化合物を0.5%カルボキシメチルセルロース水溶液に懸濁し、10 mg/kgを雄性カニクイザル1群5匹に経口投与した。経時的に採血し、血清中のインターフェロン力価は実施例56と同様の方法で測定した。投与4時間後における血清中のインターフェロン力価 (平均値±SE) は、実施例17が13,876±825 U/ml、実施例19

が $12,173 \pm 6619$  U/ml、実施例27が $14,488 \pm 6365$  U/ml、参考例2が $18,305 \pm 5578$  U/mlであり、ほぼ同等のインターフェロン誘導作用が認められた。しかしながら、参考例2では5匹中4例で嘔吐が認められたのに対し、本発明の化合物では嘔吐は1例も認められなかった。

#### 実施例59: ヒト末梢血単核球細胞 (PBMC) におけるインターフェロン誘導作用

健常ボランティア5名の末梢血をヘパリン加採血し、Lymphoprep™ (NYCOMED PHARMA AS) を用いた密度勾配遠心分離により単核球細胞 (PBMC) を調製した。PBMCを無血清 RPMI 1640培地で2回洗浄した後、10%ウシ胎仔血清添加 RPMI 1640培地で $1 \times 10^6$ 個/mlに調製し、ジメチルスルホキシド (終濃度0.1%) に溶解した被験化合物の存在下で5% CO<sub>2</sub>インキュベータ内で37℃にて24時間培養した。なお、対照には被験化合物を含まない0.1%ジメチルスルホキシドを用いた。培養上清を無菌濾過により回収し、IFN誘導活性の測定実験に供するまで-20℃以下で凍結保存した。培養上清中のヒトIFN- $\alpha$ の定量はアマシャム社の高感度ELISA systemを使用した。表4に結果を示す。(-)は検出限界 (1.25 pg/ml) 以下、NTは未試験を意味する。

表4

インターフェロン誘導活性 (pg/ml)

|        | 濃度 (nM)   |             |             |             |             |
|--------|-----------|-------------|-------------|-------------|-------------|
|        | 0.3       | 1           | 3           | 10          | 30          |
| 実施例17  | NT        | 5 $\pm$ 3   | 17 $\pm$ 17 | 50 $\pm$ 33 | 61 $\pm$ 38 |
| 実施例19  | NT        | 5 $\pm$ 1   | 12 $\pm$ 11 | 48 $\pm$ 34 | 60 $\pm$ 33 |
| 実施例25  | 7 $\pm$ 3 | 28 $\pm$ 24 | 46 $\pm$ 34 | NT          | NT          |
| 実施例27  | NT        | 6 $\pm$ 3   | 26 $\pm$ 22 | 56 $\pm$ 37 | 59 $\pm$ 33 |
| 比較例2   | -         | -           | 6 $\pm$ 5   | NT          | NT          |
| 参考化合物2 | NT        | -           | 7           | 23 $\pm$ 22 | 64 $\pm$ 40 |

#### 実施例60: 感作脾臓細胞からのTh2サイトカイン産生抑制作用

7週齢のBALB/cマウスに、10  $\mu$ gのオボアルブミンを吸着させた4 mgの水酸化アルミニウムゲル (100  $\mu$ l) を腹腔内投与して免疫し、14日後同剤で追加免疫した。その7日後、脾臓を取りだし、非働化牛胎児血清 (10%)、2-メルカプトエタ

ノール (50  $\mu$ l)、ペニシリンG (100 U/ml)、ストレプトマイシン (100  $\mu$ g/ml) を含むRPMI-1640に懸濁し、脾細胞浮遊液を調製した。脾細胞浮遊液 ( $5 \times 10^6$  cell/200  $\mu$ l/well) にオボアルブミン (0.5 mg/ml) および試験化合物を添加し、37℃、5% CO<sub>2</sub>存在下で3日間培養した。培養上清中のサイトカイン量をELISA法により定量した。IFN- $\gamma$ およびIL-4はアマシャム社、IL-5はエンドジェン社のキットを使用した。表5に結果を示す。

表 5

## IL-4產生阻害作用 (% of control)

|        | 濃度 (nM) |     |     |     |
|--------|---------|-----|-----|-----|
|        | 0.1     | 1   | 10  | 100 |
| 実施例1   | 98      | 7   | 2   | <1  |
| 実施例2   | 96      | 4   | <1  | <1  |
| 実施例10  | -       | 54  | 3   | <1  |
| 実施例17  | -       | 40  | <1  | <1  |
| 実施例19  | -       | 32  | <1  | <1  |
| 実施例20  | -       | 106 | 23  | 2   |
| 実施例21  | -       | 53  | 1   | <1  |
| 実施例22  | -       | 88  | 9   | 1   |
| 実施例25  | 86      | 2   | <1  | <1  |
| 実施例27  | -       | 30  | 1   | <1  |
| 比較例1   | -       | 18  | 1   | <1  |
| 比較例2   | 90      | 24  | 1   | <1  |
| 参考化合物1 | -       | -   | 109 | 24  |
| 参考化合物2 | 107     | 48  | 1   | <1  |

## IL-5產生阻害作用 (% of control)

|        | 濃度 (nM) |     |    |     |
|--------|---------|-----|----|-----|
|        | 0.1     | 1   | 10 | 100 |
| 実施例1   | 116     | 41  | 16 | 15  |
| 実施例2   | 98      | 37  | 14 | 12  |
| 実施例10  | -       | 91  | 32 | 15  |
| 実施例17  | -       | 77  | 24 | 10  |
| 実施例19  | -       | 83  | 16 | 13  |
| 実施例20  | -       | 106 | 71 | 19  |
| 実施例21  | -       | 97  | 23 | 15  |
| 実施例22  | -       | 115 | 50 | 18  |
| 実施例25  | 102     | 31  | 13 | 13  |
| 実施例27  | -       | 68  | 20 | 12  |
| 比較例1   | -       | 54  | 15 | 10  |
| 比較例2   | 106     | 73  | 18 | 10  |
| 参考化合物1 | -       | -   | 92 | 69  |
| 参考化合物2 | 99      | 79  | 16 | 11  |

実施例61: ラットにおける消化管吸収性

被験化合物を0.5%カルボキシメチルセルロース水溶液に懸濁し、SD系雄性ラットに経口投与した。経時的に採血し、血中の薬物濃度をHPLCにて測定した。下表にそのCmaxおよびTmaxを示す。

表 6

CmaxおよびTmax

|       | Dose<br>(mg/kg) | Cmax<br>(ng/ml) | Tmax<br>(hr) |
|-------|-----------------|-----------------|--------------|
| 実施例17 | 3               | 310             | 1            |
| 実施例19 | 3               | 188             | 4            |
| 実施例25 | 3               | 18              | 1            |
| の塩酸塩  | 10              | 150             | 0.25         |
| 実施例27 | 3               | 565             | 0.5          |
| 比較例1  | 3               | 90              | 0.5          |
| 比較例2  | 3               | 19              | 1            |
|       | 10              | 15              | 0.5          |

実施例62: 溶解度

5.53%クエン酸(1水和物)と、1.75%リン酸二ナトリウム(無水)を混合し調整した緩衝液(pH 2.5, 5.5, 7.4)に化合物を添加し、ボルテックスミキサーで攪拌、超音波で30分処理した後、再度ボルテックスミキサーで攪拌し、遠心分離(15,000rpm, 20min)する。その後、上澄中の化合物濃度をHPLCで定量した。下表にその濃度を示す。

表 7

(μg/ml)

|         | pH 2.5  | pH 5.5 | pH 7.4 |
|---------|---------|--------|--------|
| 実施例 8   | 784     | 20     | 18     |
| 実施例 9   | 350     | 4      | 3      |
| 実施例 10  | 34      | 15     | 10     |
| 実施例 15  | 140     | 1      | <1     |
| 実施例 16  | 293     | NT     | NT     |
| 実施例 19  | 130     | 2      | 2      |
| 実施例 20  | 8,813   | NT     | NT     |
| 実施例 21  | 15,000  | 45     | 64     |
| 実施例 22  | >80,000 | 73     | 16     |
| 実施例 24  | 27,000  | 22     | 1      |
| 実施例 25  | >1,000  | 5      | 3      |
| 実施例 26  | >1,000  | 6      | 3      |
| 実施例 27  | 610     | 5      | 2      |
| 実施例 28  | >1,000  | 8      | 4      |
| 実施例 31  | >1,000  | 353    | 322    |
| 実施例 32  | >1,000  | 82     | 25     |
| 参考化合物 1 | 26      | <1     | <1     |
| 参考化合物 2 | 2       | <1     | <1     |

実施例63：ラット好酸球浸潤モデルにおける実施例27の化合物の薬効評価

day 0 およびday 7に卵白アルブミン (OVA) 1 mgとAl (OH)<sub>3</sub> 100 mgを含む溶液をラット腹腔内に1 ml投与し免疫を行い、day 14に1% OVA溶液を超音波ネブライザーにて15分間噴霧し反応を惹起した。被験化合物の投与は惹起2.5時間前の気管内投与とし、惹起24時間後に気管支肺胞洗浄を行い洗浄液中の好酸球をHinkelman染色し、その数をカウントした。対照としてSensi.-/Challe.+、CMC-Na及びFluticasoneを用いた。図1及び下表にその結果を示す。

表 8

| 化合物 (気管内投与)           | x 10 <sup>4</sup> cells |        |        |
|-----------------------|-------------------------|--------|--------|
|                       | 平均                      | 標準偏差   | 標準誤差   |
| Sensi.- / Challe.+    | 26.22                   | 15.60  | 6.37   |
| CMC-Na                | 319.55                  | 281.89 | 115.08 |
| 実施例 27 0.001mg/kg     | 383.85                  | 392.01 | 160.04 |
| 実施例 27 0.01mg/kg      | 186.77                  | 161.86 | 66.08  |
| 実施例 27 0.1mg/kg       | 46.84                   | 51.84  | 21.16  |
| Fluticasone 0.01mg/kg | 300.07                  | 231.84 | 94.65  |

実施例64：マウス能動皮膚アナフィラキシーモデルにおける実施例17の化合物の薬効評価

day 0に卵白アルブミン (OVA) 2  $\mu$ gとAl (OH)<sub>3</sub> 5 mgを含む溶液をマウス腹腔内に500  $\mu$ l投与し免疫を行い、day 14にエーテル麻酔維持下で1 mg/mlのOVA溶液を左耳介に20  $\mu$ l皮内注射し反応を惹起した。被験化合物は惹起2時間前に左耳介の表裏に10  $\mu$ lずつ塗布し、惹起24時間後の耳介厚の測定をマイクロメータを用いて行った。対照としてアセトンを用いた。図2及び下表にその結果を示す。

表 9

| 化合物                    | 耳腫脹 (mm) |       |       |
|------------------------|----------|-------|-------|
|                        | 平均       | 標準偏差  | 標準誤差  |
| アセトン                   | 0.034    | 0.021 | 0.009 |
| 実施例 17 4 $\mu$ g/ear   | 0.046    | 0.024 | 0.010 |
| 実施例 17 40 $\mu$ g/ear  | 0.048    | 0.013 | 0.005 |
| 実施例 17 400 $\mu$ g/ear | 0.014    | 0.008 | 0.003 |

実施例65：担癌モデルマウスにおける実施例27の化合物の抗腫瘍効果

6週齢の雄BALB/cマウス (日本チャールス・リバー) の左腹側部にマウス腎癌由来Renca細胞株 (岩手医大より入手) を5x10<sup>4</sup> cells/0.05 ml/mouseで皮内移植した。翌日に体重測定を行い、体重の平均値がほぼ同等になるように6匹ずつ5群に分け、ピークル (0.5%カルボキシメチルセルロース (以下、CMC-Naと記載

する) 水溶液)、1 mg/kg及び3 mg/kgの実施例27の化合物を、経口ゾンテを用いて強制経口投与し(10 ml/kg)、またマウス当たり $1 \times 10^4$  U/0.1 ml及び $5 \times 10^4$  U/0.1 mlのマウスインターフェロン $\alpha$  (以下、mIFN- $\alpha$ と記載する)を背部に皮下投与した。投与は4日毎に5回実施した。形成された腫瘍の長径[L] (mm)及び短径[W] (mm)を週2回計測し、腫瘍容積[V] ( $\text{mm}^3$ )を算出した( $V=L \times W^2$ )。また、Steelの多重比較により有意差検定を行った。検定にはThe SAS system for Windows Release 8.01 (SAS Institute Inc., Cary, NC, USA)を使用した。

移植から約30日の観察期間を設け、腫瘍容積ならびに体重をモニターし、Renc a細胞株に対する抗腫瘍効果を評価した。薬剤の種類ごとにピークル投与と比較した腫瘍容積の平均値(n=6)を図3に示した。その結果、実施例27の化合物及びmIFN- $\alpha$ 投与群はピークル投与群に比べ腫瘍容積が有意に小さく( $P < 0.05$ )、実施例27の化合物投与はmIFN- $\alpha$ 投与と同等以上の抗腫瘍効果を示すことがわかった。

#### 実施例66：自然転移モデルマウスにおける実施例27の化合物の抗腫瘍効果(転移抑制効果)

6週齢の雌B6C3F1マウス(日本チャールス・リバー)の臀部に、マウスリンパ節高転移性卵巢癌由来OV2944-HM-1細胞株(広島大より入手)を $1 \times 10^6$  cells/0.05 ml/mouseで皮内移植した。移植10日後、ネンブタール麻酔下で原発腫瘍を切除した。切除部に外科用接着剤(アロンアルファ)を塗布し、ウンドクリップにて断端を縫合した。翌日に体重測定を行い、体重の平均値がほぼ同等になるように各群6匹ずつ3群に分け、ピークル(0.5% CMC-Na水溶液)、及び3 mg/kgの実施例27の化合物を、経口ゾンテを用いて強制経口投与し(10 ml/kg)、また $5 \times 10^4$  U/0.1 ml/mouseのmIFN- $\alpha$ を背部に皮下投与した。投与は4日毎に5回実施した。移植後35日目に所属リンパ節(鼠頸、上腕、腋窩)を摘出し、その湿重量を測定した。同時に肺を摘出し、転移の有無を肉眼観察した。また、Steelの多重比較により有意差検定を行った。検定にはThe SAS system for Windows Release 8.01 (SAS Institute Inc., Cary, NC, USA)を使用した。

図4に示したように、最も大きい転移巣は原発腫瘍に近い鼠頸リンパ節であり、続いて腋窩リンパ節、上腕リンパ節の順であった。実施例27の化合物投与群は、ピークル投与群に比べ各転移リンパ節重量が小さく、転移抑制効果を示した。



また、HM-1細胞株はリンパ節転移のみならず高頻度に肺転移が認められる。このことから、肺転移について検討した。下表に示したように、ピークル群では肉眼的所見で肺転移が6匹中5匹に認められたが、実施例27の化合物では全く認められなかった。このように実施例27の化合物はリンパ節転移の抑制に加え、強い肺転移抑制効果を有することが示された。一方、mIFN- $\alpha$ はリンパ節転移を抑制せず、肺転移の頻度もピークル群のそれと変わらなかった。

表 10

|                      | 6匹中肺転移の認められた匹数 |
|----------------------|----------------|
| ピークル                 | 5              |
| マウスインターフェロン $\alpha$ | 5              |
| 実施例27の化合物            | 0              |

#### 実施例67：製剤例

常法により次の組成からなる錠剤を製造した。

|                |       |
|----------------|-------|
| 実施例25の化合物      | 10mg  |
| 乳糖             | 600mg |
| でん粉            | 250mg |
| ヒドロキシプロピルセルロース | 30mg  |
| ステアリン酸カルシウム    | 5mg   |

#### 実施例68：製剤例

常法により次の組成の固体分散製剤を作成した。

|                |       |
|----------------|-------|
| 実施例27の化合物      | 20mg  |
| ニッコール(界面活性剤)   | 5mg   |
| ヒドロキシプロピルセルロース | 200mg |
| メタノール          | 2ml   |
| ジクロロメタン        | 2ml   |

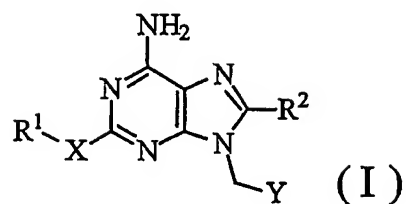
本明細書で引用した全ての刊行物をそのまま参考として本明細書中にとり入れるものとする。

#### 産業上の利用の可能性

本発明のアデニン誘導体は選択的かつ際だったインターフェロン誘導活性を有する。本発明のアデニン誘導体は、生体内でインターフェロンの分泌を促進するので、インターフェロンが有効な疾患、例えばB型及びC型肝炎、エイズなどのウイルス疾患、癌疾患などの予防又は治療に有用である。本発明のアデニン誘導体は低分子であるので、インターフェロン製剤とは異なり経口投与が可能であり、しかも水溶性に優れ消化管吸収率が高い化合物である。更に、本発明のアデニン誘導体はTh2細胞から放出されるIL-4、IL-5などの炎症性サイトカインの産生を選択的に阻害するため、喘息、アトピー性皮膚炎などのTh2細胞が深く関与している疾患の予防又は治療薬として有用である。

## 請 求 の 範 囲

## 1. 一般式 (I) :



〔式中、Xは、NR<sup>3</sup> (R<sup>3</sup>は水素原子若しくは炭素数1～3のアルキル基)、酸素原子、又は硫黄原子を表し；R<sup>1</sup>は、置換若しくは非置換のアルキル基、置換若しくは非置換のアルケニル基、置換若しくは非置換のアルキニル基、置換若しくは非置換のアリール基、又は置換若しくは非置換のヘテロアリール基を表し；R<sup>2</sup>は、水酸基、メルカプト基、炭素数1～8のアシルオキシ基、又は炭素数2～8のアルコキシカルボニルオキシ基を表し；Yは、置換若しくは非置換のナフタレン環か、置換若しくは非置換の、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む5又は6員単環芳香族ヘテロ環か、或いは、置換若しくは非置換の、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含む縮合2環性芳香族ヘテロ環を表す。〕で示されるアデニン誘導体若しくはその互変異性体又はそれらの薬学的に許容される塩。

2. 前記一般式 (I) において、R<sup>1</sup>が炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数2～8のアルキニル基、炭素数2～8のアルコキシアルキル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基、又はヘテロアリールアルキル基である請求の範囲第1項記載の化合物。

3. 前記一般式 (I) において、R<sup>1</sup>が炭素数1～6のアルキル基である請求の範囲第1項記載の化合物。

4. 前記一般式 (I) において、Xが、NHである請求の範囲第1項記載の化合物。

5. 前記一般式 (I) において、Xが、酸素原子である請求の範囲第1項記載の化合物。
6. 前記一般式 (I) において、Yが、非置換若しくは置換のピリジン環又は置換若しくは非置換のピラジン環である請求の範囲第1項記載の化合物。
7. 前記一般式 (I) において、Yが、非置換若しくは置換のナフタレン環又は置換若しくは非置換のチオフェン環である請求の範囲第1項記載の化合物。
8. 前記一般式 (I) において、Yが、炭素数1~4のアルキル基、炭素数1~4のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数1~4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2~8のジアルキルアミノ基、炭素数1~4のモノアルキルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基及びモルホリノ基からなる群から選択される置換基を、該Yがピリジン環の場合は1~4個、該Yがピラジン環の場合は1~3個任意の位置に有する請求の範囲第1項記載の化合物。
9. 前記一般式 (I) において、Yが、炭素数1~4のアルキル基、炭素数1~4のアルコキシ基、水酸基、メルカプト基、炭素数1~4のアルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、炭素数2~8のジアルキルアミノ基、炭素数1~4のモノアルキルアミノ基、ピロリジニル基、ピペリジノ基及びモルホリノ基からなる群から選択される置換基を有していてもよいピリジン環であり、R<sup>1</sup>が炭素数1~6のアルキル基であり、R<sup>2</sup>が水酸基である請求の範囲第1項記載の化合物。
10. Xが NH または酸素原子である請求の範囲第9項に記載の化合物。
11. 請求の範囲第1~10項のいずれか1項に記載の化合物を有効成分とする医薬。
12. 請求の範囲第1~10項のいずれか1項に記載の化合物を有効成分とするインターフェロン誘導剤。
13. 請求の範囲第1~10項のいずれか1項に記載の化合物を有効成分とする抗ウイルス剤。
14. 請求の範囲第1~10項のいずれか1項に記載の化合物を有効成分とする抗癌剤。
15. 請求の範囲第1~10項のいずれか1項に記載の化合物を有効成分とするタイプ2ヘルパーT細胞選択的免疫応答抑制剤。

16. 請求の範囲第1～10項のいずれか1項に記載の化合物を有効成分とする抗アレルギー剤。

17. 請求の範囲第1～10項のいずれか1項に記載の化合物を有効成分とする免疫応答調節剤。

図 1

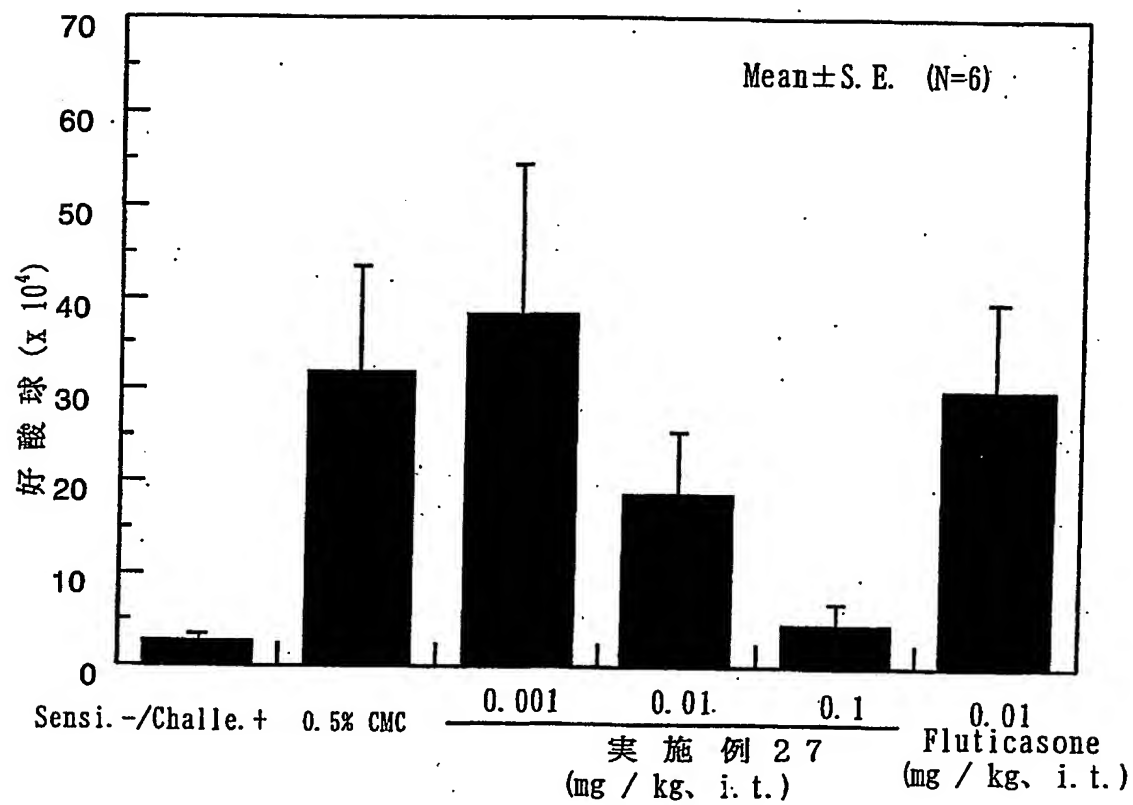


図 2

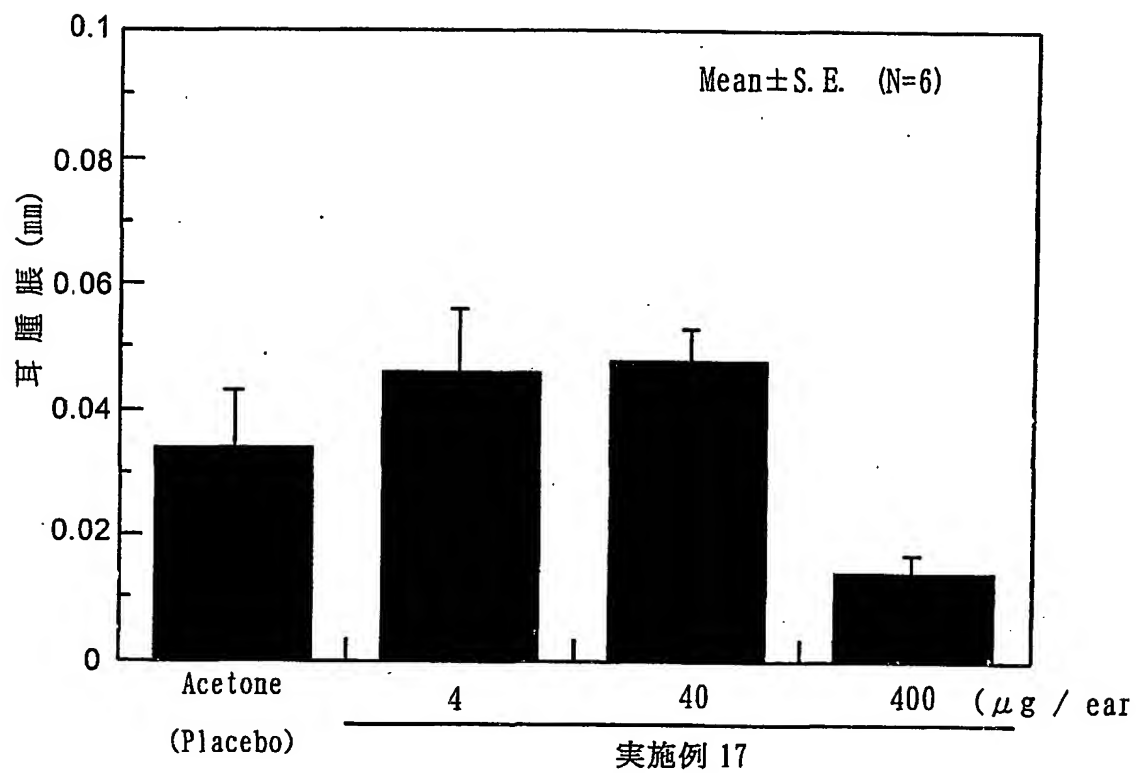
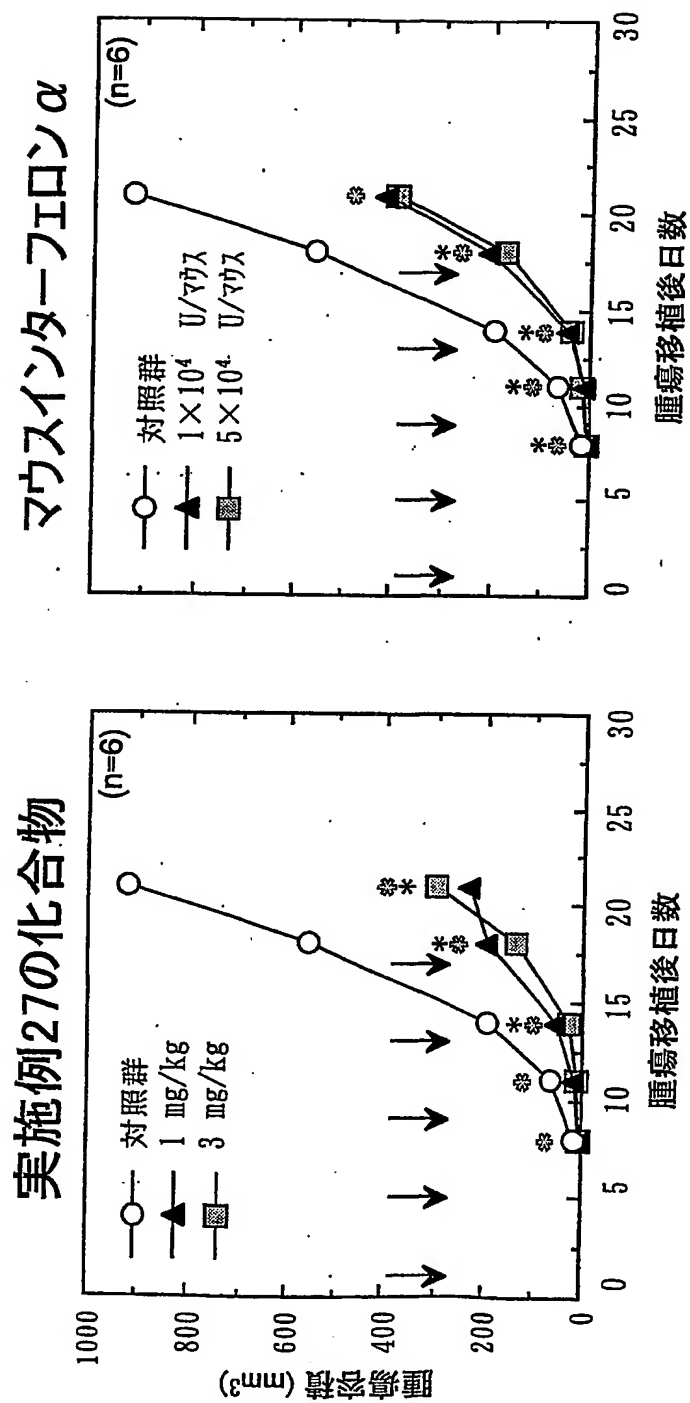


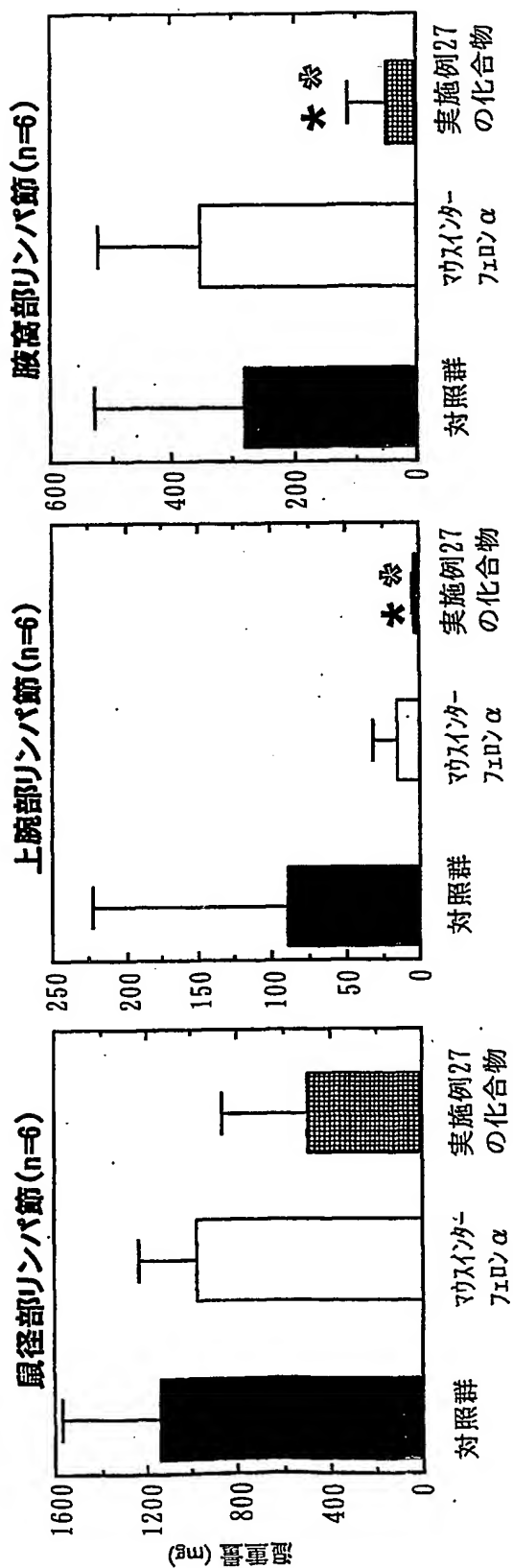
図 3



\*\*\* 対照群に対して有意差あり (Steel : p<0.05)



図 4



\* 対照群に対して有意差あり (Steel:  $p < 0.05$ )

# マスインターフェロン $\alpha$ 群に対して有意差あり (Steel:  $p < 0.05$ )

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03727

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> C07D473/16, 473/18, 473/24, A61K31/52, A61P11/06, 17/00,  
31/12, 31/18, 31/20, 35/00, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07D473/16, 473/18, 473/24, A61K31/52

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN), CAOLD (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| A         | EP 1035123 A1 (Sumitomo Pharmaceuticals Co., Ltd.),<br>13 September, 2000 (13.09.00),<br>& WO 99/28321 A1 & CA 2311742 A<br>& AU 9912602 A1 & US 6329381 B1 | 1-17                  |
| A         | JP 11-193282 A (Sumitomo Pharmaceuticals Co., Ltd.),<br>21 July, 1999 (21.07.99),<br>(Family: none)   | 1-17                  |
| A         | JP 48-16519 B1 (Tanabe Seiyaku Co., Ltd.),<br>22 May, 1973 (22.05.73),<br>(Family: none)  | 1-3                   |

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

|   |  |
|---|--|
| * Special categories of cited documents:  | "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention  |
| "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance  | "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone   |
| "E" earlier document but published on or after the international filing date  | "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art |
| "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) | "&" document member of the same patent family  |
| "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means  |  |
| "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed  |  |

Date of the actual completion of the international search  
03 July, 2002 (03.07.02)

Date of mailing of the international search report  
16 July, 2002 (16.07.02)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

|   |   |  |  |
|---|---|--|--|
| A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))<br>Int. Cl <sup>7</sup> C07D473/16, 473/18, 473/24, A61K31/52,<br>A61P11/06, 17/00, 31/12, 31/18, 31/20, 35/00, 37/02, 37/06,<br>37/08, 43/00   |   |  |  |
| B. 調査を行った分野<br>調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))<br>Int. Cl <sup>7</sup> C07D473/16, 473/18, 473/24, A61K31/52   |   |  |  |
| 最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの  |   |  |  |
| 国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)<br>REGISTRY (STN), CAPLUS (STN), CAOLD (STN)  |   |  |  |
| C. 関連すると認められる文献   |   |  |  |
| 引用文献の<br>カテゴリー*   | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示   | 関連する<br>請求の範囲の番号   |  |
| A   | EP 1035123 A1 (SUMITOMO PHARMACEUTICALS COMPANY, LIMITED)<br>2000. 09. 13<br>& WO 99/28321 A1 & CA 2311742 A & AU 9912602 A1<br>& US 6329381 B1 | 1-17   |  |
| A   | JP 11-193282 A (住友製薬株式会社) 1999. 07. 21<br>(ファミリーなし)   | 1-17   |  |
| A   | JP 48-16519 B1 (田辺製薬株式会社) 1973. 05. 22<br>(ファミリーなし)   | 1-3  |  |
| <input type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。  |   |  |  |
| * 引用文献のカテゴリー<br>「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの<br>「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの<br>「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)<br>「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献<br>「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願 |   | の日の後に公表された文献<br>「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの<br>「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの<br>「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの<br>「&」 同一パテントファミリー文献 |  |
| 国際調査を完了した日<br>03. 07. 02  |   | 国際調査報告の発送日<br>16.07.02   |  |
| 国際調査機関の名称及びあて先<br>日本国特許庁 (ISA/JP)<br>郵便番号100-8915<br>東京都千代田区霞が関三丁目4番3号  |   | 特許庁審査官 (権限のある職員)<br>中木 亜希<br>電話番号 03-3581-1101 内線 3492   |  |

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**